

This Page Is Inserted by IFW Operations
and is not a part of the Official Record

BEST AVAILABLE IMAGES

Defective images within this document are accurate representation of
The original documents submitted by the applicant.

Defects in the images may include (but are not limited to):

- BLACK BORDERS
- TEXT CUT OFF AT TOP, BOTTOM OR SIDES
- FADED TEXT
- ILLEGIBLE TEXT
- SKEWED/SLANTED IMAGES
- COLORED PHOTOS
- BLACK OR VERY BLACK AND WHITE DARK PHOTOS
- GRAY SCALE DOCUMENTS

IMAGES ARE BEST AVAILABLE COPY.

**As rescanning documents *will not* correct images,
please do not report the images to the
Image Problem Mailbox.**

File Copy



Europäisches Patentamt
European Patent Office
Office européen des brevets



(11) Veröffentlichungsnummer: 0 447 891 A1

(12)

EUROPÄISCHE PATENTANMELDUNG

(21) Anmeldenummer: 91103547.5

(51) Int. Cl. 5: C07D 495/04, A01N 49/00

(22) Anmeldetag: 08.03.91

(30) Priorität: 19.03.90 DE 4008726

W-6704 Mutterstadt(DE)

Erfinder: Etzbach, Karl-Heinz, Dr.

Carl-Bosch-Ring 55

W-6710 Frankenthal(DE)

Erfinder: Hofmeister, Peter, Dr.

Barnard-Humboldt-Strasse 12

W-6730 Neustadt(DE)

Erfinder: Kuenast, Christoph, Dr.

Salierstrasse 2

W-6701 Otterstadt(DE)

Erfinder: Westphalen, Karl-Otto, Dr.

Mausbergstrasse 58

W-6720 Speyer(DE)

(43) Veröffentlichungstag der Anmeldung:
25.09.91 Patentblatt 91/39

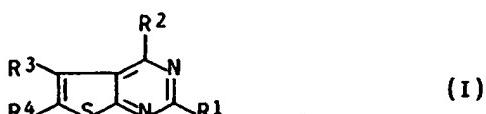
(84) Benannte Vertragsstaaten:
BE CH DE DK ES FR GB IT LI NL

(71) Anmelder: BASF Aktiengesellschaft
Carl-Bosch-Strasse 38
W-6700 Ludwigshafen(DE)

(72) Erfinder: Wiesenfeldt, Matthias, Dr.
Rosenstrasse 10

(54) Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate.

(57) Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formeln I



in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

R¹ Wasserstoff, C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₃-Chloralkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl

R² Fluor, Chlor, Brom, Jod, Hydroxy, Azido, Cyano, Thiocyanato, Mercapto, ein nicht über Stickstoff gebundener organischer Rest oder ein Rest NR⁵R⁶, worin R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder organische Reste bedeuten oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 8 Ringatomen bilden, mit der Maßgabe, daß R² nicht Phenoxy-C₂-C₃-alkylamino bedeutet,

R³ Chlor, Brom, Hydroxy oder Mercapto, mit der Maßgabe, daß nicht gleichzeitig R² Hydroxy und R³ Brom bedeutet und daß nicht gleichzeitig R³ Hydroxy und R⁴ Alkoxy carbonyl oder Carboxy bedeutet,

R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Mono-, Di- oder Trihalogenalkyl, Phenyl, Cyano, Formyl, Hydroxymethyl, Carboxy, Alkoxy carbonyl, Aminocarbonyl oder einen Rest der Formel

CH=X

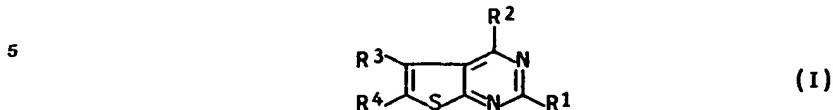
worin X der über Stickstoff gebundene Rest eines primären Amins oder der über der Kohlenstoff gebundene Rest einer methylenaktiven Verbindung ist,

sowie die Tautomeren dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und die nutzplanzenverträglichen Salze dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und ihrer Tautomeren.

Die Verbindungen I finden als Insektizid, Wachstumsregulatoren und Herbizide Verwendung.

EP 0 447 891 A1

Die vorliegende Erfindung betrifft neue Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formel I



in der die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- 10 R¹ Wasserstoff, C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₃-Chloralkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl
- R² Fluor, Chlor, Brom, Jod, Hydroxy, Azido, Cyano, Thiocyanato, Mercapto, ein nicht über Stickstoff gebundener organischer Rest oder ein Rest NR⁵R⁶, worin R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander Wasserstoff, Amino oder organische Reste bedeuten oder gemeinsam mit dem Stickstoffatom einen heterocyclischen Rest mit 3 bis 8 Ringatomen bilden, mit der Maßgabe, daß R² nicht
- 15 Phenoxy-C₂-C₃-alkylamino bedeutet,
- R³ Chlor, Brom, Hydroxy oder Mercapto mit der Maßgabe, daß nicht gleichzeitig R² Hydroxy und R³ Brom bedeutet und daß nicht gleichzeitig R³ Hydroxy und R⁴ Alkoxy carbonyl oder Carboxy bedeutet,
- R⁴ Wasserstoff, C₁-C₆-Alkyl, C₃-C₆-Mono-, Di- oder Trihalogenalkyl, Phenyl, Cyano, Formyl, Hydroxymethyl, Carboxy, Alkoxy carbonyl, Aminocarbonyl oder ein Rest der Formel

20 CH=X

25 worin X der über Stickstoff gebundene Rest eines primären Amins oder über der Kohlenstoff gebundene Rest einer methylenaktiven Verbindung ist,

sowie die Tautomeren dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und die nutzpflanzenverträglichen Salze dieser Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate und ihrer Tautomeren.

Außerdem betrifft die Erfindung die Herstellung der Verbindungen I, Mittel zur Bekämpfung von Schadpflanzen und Schadinsekten sowie zur Regulierung des Wachstums von Nutzpflanzen, die Verbindungen I als Wirkstoffe enthalten, sowie die Verwendung der Verbindungen I als Herbizide, Schädlingsbekämpfungsmittel oder Wachstumsregulatoren.

In der DE-A-26 54 090 und der US-A 4,196,207 sind Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate mit fungiziden, bakteriziden, antiviralen, wachstumsregulierenden und insektiziden bzw. akariziden Eigenschaften beschrieben, die in 5-Position auch halogensubstituiert sein können. In der Beschreibung und in den Beispielen werden jedoch nur Wasserstoff und Methyl als Substituenten in der 5-Position genannt. Die Wirksamkeit dieser Substanzen als Herbizide, Schädlingsbekämpfungsmittel und wachstumsregulierende Mittel ist unbefriedigend. Weiterhin sind aus den Arbeiten von M.M. Robba et al. (C.R. Acad. Sc. Paris (1968), 267, 697-700) und N.V. Kaplina et al. (Pharm. Chem. Journal (1987), 21 (2) 126-129) Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate bekannt, in denen in 4-Stellung Hydroxy und in 5-Stellung Brom steht. Kaplina et al. haben diese Verbindungen auf antivirale Aktivität untersucht. Ferner haben S. Kohra et al. (J.Het. Chem., (1988), 25, 959-968) das 4,5-Dihydroxy-6-methoxycarbonyl-2-phenyl-thieno[2,3-d]pyrimidin beschrieben. Eine Methode zur Herstellung von 4-Oxo-, 4-Thio- oder 4-Imino-thieno[2,3-d]pyrimidinen wird in der IN-151 496 beansprucht.

Der Erfindung lag die Aufgabe zugrunde, neue Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate mit herbiziden und verbesserten wachstumsregulierenden sowie verbesserten insektiziden Wirkungen bereitzustellen.

Demgemäß wurden die eingangs definierten Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate I gefunden. Die Verbindungen I weisen bemerkenswerte insektizide, herbizide und wachstumsregulierende Eigenschaften auf.

Die Verbindungen I, in denen R² und/oder R³ für die Hydroxy oder die Mercaptogruppe stehen, bilden Keto-Enol-Tautomere. Beide Formen gehören ebenso zu den Verbindungen nach der Erfindung wie die pflanzenverträglichen Salze, z.B. von Mineralsäuren, wie Salzsäure, Schwefelsäure oder Phosphorsäure, oder von organischen Säuren, wie Essigsäure, Malonsäure, Bernsteinsäure oder Fumarsäure.

Unter den Verbindungen I sind diejenigen bevorzugt, in denen die Substituenten die folgende Bedeutung haben:

- R¹ Wasserstoff, C₁-C₅-Alkyl, C₁-C₃-Chloralkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl, Phenyl oder Benzyl
- 55 R² Hydroxy, Fluor, Chlor, Brom, Azido, Cyano, Thiocyanato, C₁-C₂₀-Alkoxy, C₃-C₆-Alkenyloxy, C₃-C₆-Alkinyloxy, C₁-C₄-Alkoxy-C₂-C₆-alkoxy, Phenoxy-C₂-C₆-alkoxy, C₃-C₁₂-Cycloalkoxy, Hydroxy-C₂-C₆-alkoxy, Chlor-C₂-C₆-alkoxy, Phenoxy oder Benzyloxy, Phenylethoxy, Amino-C₂-C₆-alkoxy, Bis(C₁-C₄-alkyl)amino-C₂-C₆-alkoxy, Hydroxy-C₁-C₄-alkylamino-C₂-C₆-alkoxy, Mercapto, C₁-C₁₈-

17

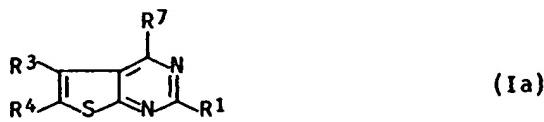
Alkylthio, C₃-C₆-Cycloalkylthio, C₃-C₆-Alkenylthio, C₃-C₆-Alkinylthio, Hydroxy-C₂-C₆-alkylthio, Bis-C₁-C₃-alkylamino-C₂-C₆-alkylthio, Carboxy-C₁-C₄-alkylthio, C₁-C₃-Alkoxy carbonyl-C₁-C₂-alkylthio, Furylmethylthio, Phenylthio oder Benzylthio, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl methyl, Carboxym thyl, Bis-(C₁-C₄-alkoxycarbonyl)methyl, α -C₁-C₄-Alkoxy carbonyl- α -cyanomethyl, Dicyanomethyl, Bis-(carboxy)methyl, α -Cyano- α -phenyl-methyl, Pyrrolidino, Piperidino, Morpholino, Hexamethylenimino, N-Methylpiperazino, N-Ethylpiperazino, Imidazolyl, Pyrazolyl, Triazolyl, Tetrazolyl, Thiomorpholino, Hydrazino, C₁-C₃-Alkylhydrazino, Bis-(C₁-C₃-alkyl)hydrazino, Phenylhydrazino, Hydroxylamino, Morpholin-(1)-yl-amino, Hexamethylenimino-(1)-yl-amino, einen Rest NR⁵R⁶, worin R⁵ und R⁶ unabhängig voneinander für Wasserstoff, C₁-C₂₀-Alkyl, C₃-C₂₀-Alkenyl, C₃-C₆-Alkinyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, C₃-C₆-Cycloalkyl-C₁-C₄-alkyl, Hydroxy-C₂-C₆-Alkyl, Amino-C₂-C₁₂-alkyl, Bis-C₁-C₄-alkylamino-C₂-C₆-alkyl, Piperazin-(1)-yl-C₂-C₄-alkyl, Morpholin-(1)-yl-C₂-C₄-alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₁-C₄-alkyl, Phenoxy-C₄-C₆-Alkyl, Benzyloxy-C₂-C₆-alkyl, Hydroxy-C₂-C₃-alkoxy-C₂-C₆-alkyl, Hydroxy-C₂-C₄-alkylamino-C₂-C₄-alkyl, C₂-C₃-Alkoxy-C₂-C₃-alkoxy-C₂-C₆-alkyl, Phenoxy-C₂-C₄-alkoxy-C₂-C₄-alkyl, Bis-hydroxymethyl-C₁-C₃-alkyl, Cyano-C₂-C₁₀-alkyl, Carboxy-C₂-C₁₀-alkyl, C₁-C₃-Alkoxy-C₂-C₃-alkoxy-C₂-C₃-alkyl, Phenyl, Phenyl-C₁-C₄-alkyl, C₃-C₁₂-Cycloalkyl, Pyridyl, Furyl, Thienyl, Methylpyridyl, Pyridylmethyl, Furylmethyl, Thienylmethyl oder Adamantyl stehen,
wobei, wenn R¹ und/oder R² Phenyl bedeuten oder enthalten, dieser Phenylrest bis zu 3 gleiche oder verschiedene Substituenten, wie C₁-C₄-Alkyl, C₁-C₄-Alkoxy, Halogen, Nitro, Amino, Hydroxy, Hydroxy-C₁-C₄-alkyl, Cyano, Carboxy, Aminocarbonyl, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, C₁-C₄-Acyl oxy, C₂-C₆-Acylamino, C₁-C₄-Alkylamino, C₁-C₃-Acyl, Carboxy-C₁-C₂-alkyl, Di-C₁-C₄-alkylamino sowie Trifluormethyl und insbesondere Fluor, Chlor, Brom, Jod, Methyl, Ethyl, Amino, Hydroxy, Methoxy, Etheno, Acetylamino oder Acetyl tragen kann,
R³ Chlor, Brom oder Hydroxy
R⁴ Wasserstoff, Methyl, C₁-C₂-Mono- oder Dichloralkyl, Cyano, Carboxy, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl, Aminocarbonyl oder CH=X, worin X für C₁-C₂₀-Alkylimino, Phenylimino, Carboxymethylen, α -C₁-C₄-Alkyl- α -carboxymethylen, α -Phenyl- α -carboxymethylen, Dicarboxymethylen, Cyanomethylen, α -C₁-C₄-Alkyl- α -cyanomethylen, α -Phenyl- α -cyanomethylen, Dicyanomethylen, Formylmethylen, α -C₁-C₄-Alkyl- α -formylmethylen, α -Phenyl- α -formylmethylen, Diformylmethylen, C₁-C₄-Alkoxy carbonyl methylen, α -C₁-C₄-Alkyl- α -C₁-C₄-Alkoxy carbonyl methylen, C₁-C₄-Dialkoxy carbonyl methylen, α -Cyano- α -C₁-C₄-alkoxy carbonyl methylen oder α -Phenyl- α -C₁-C₄-alkoxy carbonyl methylen steht.
Für den erfundungsgemäßen Zweck bevorzugte Verbindungen sind in Tabelle 1 aufgeführt, wobei die Verbindungen 4,5-Dichloro-6-methyl- (Nr. 12), 4-n-Propylamino-5-chloro- (Nr. 144), 4-n-Butylamino-5-chloro- (Nr. 146), 4-sek.Butylamino-5-chloro- (Nr. 147), 4-n-Hexylamino-5-chloro- (Nr. 154), 4-n-Heptylamino-5-chloro- (Nr. 155), 4-n-Octylamino-5-chloro- (Nr. 156), 4-n-Nonylamino-5-chloro- (Nr. 157), 4-(2-Methyl-hept-6-ylamino)-5-chloro- (Nr. 168), 4-(1-Ethoxyprop-3-ylamino)-5-chloro- (Nr. 185), 4-Benzylamino-5-chloro- (Nr. 275), 4-Phenylethylamino-5-chloro- (Nr. 282), 4-(Prop-1-in-3-ylamino)-5-chloro- (Nr. 293) und 4-(Hept-6-ylamino)-5-chloro-thieno[2,3-d]pyrimidin (Nr. 395) besonders bevorzugt sind.
Die erfundungsgemäßen Verbindungen I können z.B. hergestellt werden, indem man Thiophenderivate der allgemeinen Formel II



45 mit einem Dialkylamid III



50 in dem T¹ und T² unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl oder zusammen mit dem Amidstickstoff für einen 5 bis 7 gliedrigen gesättigten Heterocyclus stehen, in Gegenwart von 2 bis 20 mol Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid, bezogen auf 1 mol II, zu Thieno(2,3-d)pyrimidinderivaten d r allg m inen Formel Ia



in der R⁷ für Chlor oder Brom steht, umsetzt und in diesen gegebenenfalls R⁷ in an sich üblicher Weise gegen andere Nucleophile Reste R² austauscht.

10 Geeignete Dialkylamide III sind zum Beispiel N,N-Dimethylformamid, N,N-Dimethylacetamid, N,N-Diethylformamid, N,N-Diethylacetamid, N,N-Dimethylpropionamid und N,N-Dimethylbenzoësäureamid.

Wichtig für das erfindungsgemäße Verfahren ist die Verwendung eines Überschusses von Phosphorylchlorid bzw. Phosphorylbromid bezogen auf das eingesetzte Thiophenderivat II. Es kann auch vorteilhaft sein, die Reaktion in dem geeigneten Phosphorylhalogenid als Lösungsmittel durchzuführen. Man verwendet bevorzugt 2 bis 6 mol Phosphorylhalogenid pro Mol II.

15 Das Molverhältnis von Thiophenderivat II zu N,N-Dialkylamid III beträgt in der Regel 1:1 bis 1:5.

Zweckmäßig wird die Reaktion in einem inerten Lösungsmittel, wie Chlorbenzol, Nitrobenzol, Benzoesäuremethylester, Methylenechlorid, Dichlorbenzol, Trichlorbenzol, Benzoësäureethylester, Chloroform, Tetrachlorkohlenstoff, eines der oben beschriebenen N,N-Dialkylamide, Trichlorethan, Hexamethylphosphorsäuretriamid (HMPT) oder Tetrachlorethylen, durchgeführt. Bevorzugte Lösungsmittel sind Phosphorylchlorid, 20 Phosphorylbromid oder eines der oben beschriebenen N,N-Dialkylamide.

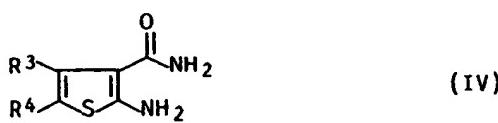
Die Reaktion verläuft ab etwa 20 °C mit ausreichender Geschwindigkeit. Bei Temperaturen von über 150 °C sinkt die Spezifität der Reaktion. Vorzugsweise führt man die Reaktion in einem Temperaturbereich von 50 bis 110 °C durch.

25 Die Verwendung von katalytischen Mengen einer Lewis Säure, wie Kaliumchlorid, Natriumchlorid, Eisen(III)-chlorid, Aluminiumchlorid, Zinkchlorid, Zinnchlorid, Antimonpentafluorid, Bortrichlorid, Titanetetrachlorid, oder eines basischen Katalysators wie N,N-Dimethylanilin oder N,N-Diethylanilin, kann zu einer Steigerung der Reaktionsgeschwindigkeit und einer Erhöhung der Ausbeute führen.

30 Die so erhaltenen Verbindungen der allgemeinen Formel Ia kann man nach bekannten Methoden (The Chemistry of Heterocyclic Compounds, "The pyrimidines", ed. D. J. Brown, J. Wiley & Sons, New York, London, Vol. 16, (1962); Vol. 16, Suppl. 1, (1970); Vol. 16, Suppl. 2 (1985)) durch den Austausch des Halogenatoms in Position 4 gegen andere nucleophile Reste R² in die korrespondierenden Verbindungen Ib umwandeln.

Ein weiteres Verfahren zur Herstellung der Thienopyrimidinderivate der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, ist dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel IV

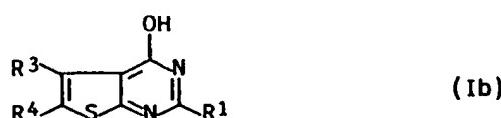
35



40

in der die Substituenten R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, in an sich üblicher Weise mit einem Säureanhydrid, das mindestens einen Rest R¹-CO- enthält, oder einer Carbonsäure R¹-COOH, oder einem Addukt aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wobei R¹ jeweils die 45 angegebene Bedeutung hat, zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib

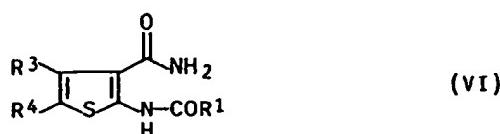
50



umsetzt, diese mit einem Phosphorylhalogenid in Verbindungen der allgemeinen Formel Ia gemäß Anspruch 2 überführt und in diesen gegebenenfalls R⁷ in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophil 55 Reste R² austauscht.

In bestimmten Fällen ist es zweckmäßig, die Umsatzung von IV zu Ib in zwei Schritten durchzuführen, d.h. die als Zwischenprodukt auftretenden V in der allgemeinen Formel VI

5



zu isolieren.

In der Regel setzt man das Säureanhydrid oder das Addukt in Mengen von 100 bis 500 mol-%, bevorzugt 100 bis 300 mol-%, bezogen auf die Verbindungen IV, ein.

10 Die Carbonsäureanhydride, die mindestens einen Rest R¹-CO- enthalten, können aus zwei Carbonsäuren R¹-COOH, wie Pivalinsäure, Propionsäure oder Essigsäure; oder aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Oxosäure, wie Phosphorsäure oder Schwefelsäure, aufgebaut sein.

Bevorzugte Carbonsäuren R¹-COOH sind solche mit 1 bis 4 Kohlenstoffatomen, insbesondere Ameisensäure und Essigsäure.

15 Außerdem kommen auch Addukte aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wie Zinkchlorid, Bortrifluorid oder Titanetrachlorid, in Betracht.

Die Umsetzung von IV zu Ib erfolgt vorteilhaft in inerten Lösungsmitteln, wie N,N-Dialkylamiden, von denen N,N-Dimethylformamid und Dimethylacetamid besonders bevorzugt sind, N-Methylpyrrolidon, N,N-Dimethylpropylenhamstoff oder Hexamethylphosphorsäuretriamid, bei Temperaturen von (-10) bis 150 °C, vorzugsweise 20 bis 120 °C, insbesondere 80 bis 120 °C.

Für den Fall, daß man die intermediär auftretenden Verbindungen VI isolieren will, wählt man vorzugsweise Reaktionstemperaturen zwischen (-10) und 80 °C.

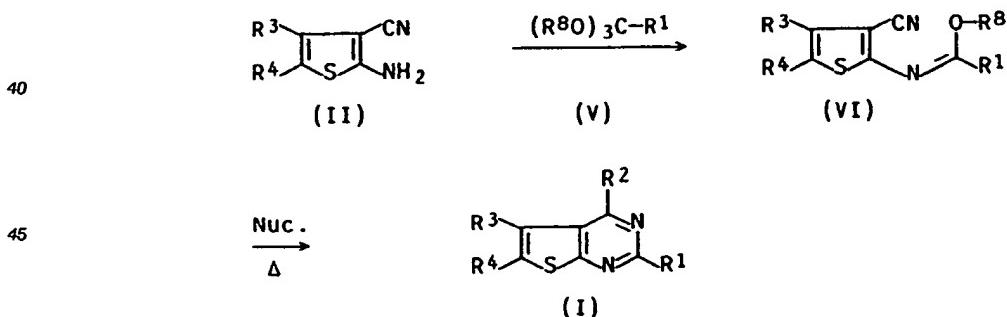
20 In der Regel gibt man eine Base wie Triethylamin, N-Methylpyrrolidon oder N,N-Dimethylanilin, in einem 1- bis 10-fachen Überschuß, bevorzugt 1- bis 5-fachen Überschuß zu, bezogen auf das Carbonsäureanhydrid, die Carbonsäure oder das Carbonsäure-Lewissäure-Addukt.

Der Zusatz eines wasserentziehenden Reagenzes, wie Dicyclohexylcarbodiimid, oder eines Vilsmeier-Reagenzes kann die Reaktion beschleunigen und die Ausbeute an Ib erhöhen.

25 Die Hydroxygruppe in 4-Stellung der Verbindungen Ib kann man anschließend nach an sich bekannten Methoden beispielsweise mit Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid gegen Chlor oder Brom austauschen.

Gegebenenfalls kann man das Chlor bzw. Brom in 4-Stellung nach an sich bekannten Methoden gegen andere nucleophile Reste R² substituieren.

Auch durch die Umsetzung der Verbindungen II mit Orthoestern (V) gemäß Anspruch 4 zu den Thiophenderivaten VI und anschließende Cyclisierung in Gegenwart eines geeigneten Nucleophils können 30 die erfindungsgemäßen Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate I erhalten werden.



50 Die zuletzt beschriebene Reaktionsfolge ist an sich aus der DE-A 26 54 090 bekannt. Die Thiophenderivate II und IV kann man nach den in der EP-A1 0193 885 beschriebenen Vorschriften erhalten.

Zur Darstellung von pflanzenverträglichen Salzen kann man die Thieno(2,3-d)pyrimidinderivate I mit üblicherweise verwendeten Salzbildnern, wie Chlorwasserstoffsäure, Bromwasserstoffsäure, Jodwasserstoffsäure, Schwefelsäure, Phosphorsäure, Ameisensäure, Essigsäure, Oxalsäure, Benzolsulfonsäure, p-Toluolsulfonsäure, Dodecybenzolsulfonsäure, Methylbromid, Dimethylsulfat oder Diethylsulfat im Temperaturbereich von 0 bis 150 °C, vorzugsweise 20 bis 120 °C, umsetzen.

Die Salzbildung wird zweckmäßig zweiseitig in einem Lösungsmittel oder Verdünnungsmittel durchgeführt. Hierzu eignen sich beispielsweise aliphatische Kohlenwasserstoffe, wie n-Pantan, n-Hexan oder Propanether,

aromatische Kohlenwasserstoffe, wie Benzol, Toluol oder Xylole, Benzin oder Ether, wie Diethylether, Methyl-tert.-butylether, Tetrahydrofuran oder Dioxan, ferner Ketone, wie Aceton, Methylethylketon oder Methylisopropylketon, sowie halogenierte Kohlenwasserstoffe, wie Chlorbenzol, Methylenchlorid, Ethylenchlorid, Chloroform und Tetrachlorethyl u. n. Auch Gemische dieser Lösungsmittel können verwendet werden.

- 5 Zur Herstellung der Salze der Verbindungen I setzt man die Ausgangsstoffe üblicherweise in stöchiometrischem Verhältnis ein. Ein Überschuss der einen oder anderen Komponente kann von Vorteil sein.

Die erfindungsgemäßen Herbizide, Wachstumsregulatoren und Schädlingsbekämpfungsmittel können beispielsweise direkt versprühbare Lösungen, Pulver, Suspensionen, auch hochprozentige wässrige, ölige oder sonstige Suspensionen, wässrige oder ölige Dispersionen, Emulsionen, Pasten, Stäubemittel, Streumittel oder Granulate sein und durch Versprühen, Vernebeln, Verstäuben, Verstreuen oder Gießen angewendet werden. Die Anwendungformen richten sich nach den Verwendungszwecken; sie sollten in jedem Fall eine möglichst feine Verteilung der erfindungsgemäßen Wirkstoffe gewährleisten.

Als inerte Trägerstoffe kommen Mineralölfraktionen von mittlerem bis hohem Siedepunkt, wie Kerosin oder Dieselöl, ferner Kohlenteeröle sowie Öle pflanzlichen oder tierischen Ursprungs, aliphatische, cyclische und aromatische Kohlenwasserstoffe, z.B. Toluol, Xylol, Paraffin; Tetrahydronaphthalin, alkylierte Naphthaline oder deren Derivate, Methanol, Ethanol, Propanol, Butanol, Cyclohexanol, Cyclohexanon, Chlorbenzol, Isophoron oder stark polare Lösungsmittel wie N,N-Dimethylformamid, N-Methylpyrrolidon oder Wasser in Betracht.

Wässrige Anwendungsformen können aus Emulsionskonzentraten, Dispersionen, Pasten, netzbaren Pulvern oder wasserdispergierbaren Granulaten durch Zusatz von Wasser bereitstellt werden. Zur Herstellung von Emulsionen, Pasten oder Öldispersionen können die Substrate als solche oder in einem Öl oder Lösungsmittel gelöst, mittels Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel in Wasser homogenisiert werden. Es können aber auch aus wirksamer Substanz, Netz-, Haft-, Dispergier- oder Emulgiermittel und eventuell Lösungsmittel oder Öl bestehende Konzentrate hergestellt werden, die zur Verdünnung mit Wasser geeignet sind.

Oberflächenaktive Stoffe erleichtern die feine Verteilung. Als solche kommen Alkali-, Erdalkali-, Ammoniumsalze von Ligninsulfinsäure, Naphthalinsulfinsäure, Phenolsulfinsäure, Dibutylnaphthalinsulfinsäure; Alkylarylsulfonate, Alkylsulfate, Alkylsulfonate, Fettsulfat, Fettsäuren sowie deren Alkali- und Erdalkalisalze, Salze von sulfatiertem Fettkoholglykolether, Kondensationsprodukte von sulfonierte 30 Naphthalin und Naphthalinderivaten mit Formaldehyd, Kondensationsprodukte des Naphthalins bzw. der Naphthalinsulfinsäure mit Phenol und Formaldehyd, Alkylarylpolyglykolether, wie ethoxyliertes Isooctylphenol, Octylphenol, Nonylphenol, Tributylphenylpolyglykolether, Fettkoholethoxylate, wie Isotridecylethoxylat und wie ethoxyliertes Rizinusöl, Kondensationsprodukte aus Ethylenoxid und Propylenoxid, wie ethoxyliertes Polyoxypropenyl, Sorbitester, Lignin-Sulfitablaugen und Methylcellulose in Betracht.

35 Pulver-, Streu- und Stäubemittel können durch Mischen oder gemeinsames Vermahlen der wirksamen Substanzen mit einem festen Trägerstoff hergestellt werden.

Granulate, z.B. Umhüllungs-, Imprägnierungs- und Homogengranulat, können durch Bindung der Wirkstoffe an feste Trägerstoffe hergestellt werden. Feste Trägerstoffe sind Mineraleden wie Silicagel, Kieselsäuren, Kieselgele, Silikate, Talkum, Kaolin, Kalkstein, Kalk, Kreide, Bolus, Löß, Ton, Dolomit, 40 Diatomeenerde, Calcium- und Magnesiumsulfat, Magnesiumoxid, gemahlene Kunststoffe, Düngemittel, wie Ammoniumsulfat, Ammoniumphosphat, Ammoniumnitrat, Harnstoffe und pflanzliche Produkte, wie Getreide- mehl, Baumrinden-, Holz- und Nußschalenmehl, Cellulosepulver oder andere feste Trägerstoffe.

Die Formulierungen enthalten üblicherweise zwischen 0,01 und 99 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 70 Gew.-%, Wirkstoff. Die Wirkstoffe werden zweckmäßig in einer Reinheit von 80 % bis 99,9 %, 45 vorzugsweise 90 % bis 99 % (nach NMR-Spektrum) eingesetzt

Die erfindungsgemäßen Verbindungen I können beispielsweise wie folgt formuliert werden:

- I. Man vermischt 90 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 431 mit 10 Gewichtsteilen N-Methyl- α -pyrrolidon und erhält eine Lösung, die zur Anwendung in Form kleinstter Tropfen geeignet ist.
- II. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 154 werden in einer Mischung gelöst, die aus 80 Gewichtsteilen Xylol, 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 8 bis 10 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ölsäure-N-monoethanolamid, 5 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfinsäure und 5 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Ausgießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wässrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- III. 20 Gewichtsteile der Verbindung Nr. 155 werden in einer Mischung gelöst, die aus 40 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 30 Gewichtsteilen Isobutanol, 20 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 7 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Isooctylphenol und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000

- Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- IV. 20 Gewichtsteil des Wirkstoffs Nr. 168 werden in einer Mischung gelöst, die aus 25 Gewichtsteilen Cyclohexanon, 65 Gewichtsteil in einer Mineralölfraktion vom Siedepunkt 210 bis 280 °C und 10 Gewichtsteilen des Anlagerungsproduktes von 40 Mol Ethylenoxid an 1 Mol Ricinusöl besteht. Durch Eingießen und feines Verteilen der Lösung in 100 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine wäßrige Dispersion, die 0,02 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- V. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 385 werden mit 3 Gewichtsteilen des Natriumsalzes der Diisobutylnaphthalin- α -sulfonsäure, 17 Gewichtsteilen des Natriumsalzes einer Ligninsulfonsäure aus einer Sulfit-Ablauge und 60 Gewichtsteilen pulverförmigem Kiesel säuregel gut vermischt und in einer Hammermühle vermahlen. Durch feines Verteilen der Mischung in 20 000 Gewichtsteilen Wasser erhält man eine Spritzbrühe, die 0,1 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VI. 3 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 274 werden mit 97 Gewichtsteilen feinteiligem Kaolin vermischt oder vermahlen. Man erhält auf diese Weise ein Stäubemittel, das 3 Gew.% des Wirkstoffs enthält.
- VII. 30 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 281 werden mit einer Mischung aus 92 Gewichtsteilen pulverförmigem Kiesel säuregel und 8 Gewichtsteilen Paraffinöl, das auf die Oberfläche dieses Kiesel säuregels gesprührt wurde, innig vermischt oder vermahlen. Man erhält auf diese Weise eine Aufbereitung des Wirkstoffs mit guter Haftfähigkeit.
- VIII. 20 Gewichtsteile des Wirkstoffs Nr. 292 werden mit 2 Gewichtsteilen Calciumsalz der Dodecylbenzolsulfonsäure, 8 Gewichtsteilen Fettalkohol-polyglykolether, 2 Gewichtsteilen Natriumsalz eines Phenol-Harnstoff-Formaldehyd-Kondensates und 68 Gewichtsteilen eines paraffinischen Mineralöls innig vermischt oder vermahlen. Man erhält eine stabile ölige Dispersion.

Die Applikation der herbiziden und wachstumsregulierenden Mittel bzw. der Wirkstoffe kann im Vorauflauf- oder im Nachlaufverfahren erfolgen. Sind die Wirkstoffe für gewisse Kulturpflanzen weniger verträglich, so können Ausbringungstechniken angewandt werden, bei welchen die herbiziden Mittel mit Hilfe der Spritzgeräte so gespritzt werden, daß die Blätter der empfindlichen Kulturpflanzen nach Möglichkeit nicht getroffen werden, während die Wirkstoffe auf die Blätter darunter wachsender unerwünschter Pflanzen oder die unbedeckte Bodenfläche gelangen (post-directed, lay-by).

In Anbetracht der Vielseitigkeit der Applikationsmethoden können die erfindungsgemäßen Verbindungen bzw. sie enthaltende Mittel in einer großen Zahl von Kulturpflanzen zur Beseitigung unerwünschter Pflanzen eingesetzt werden.

Zur Verbreiterung des Wirkungsspektrums und zur Erzielung synergistischer Effekte können die erfindungsgemäßen Verbindungen I mit zahlreichen Vertretern anderer herbizider oder wachstumsregulierender Wirkstoffgruppen gemischt und gemeinsam ausgebracht werden. Beispielsweise kommen als Mischungspartner Diazine, 4H-3, 1-Benzoxazinderivate, Benzothiadiazinone, 2,6-Dinitroaniline, N-Phenylcarbamate, Thiolcarbamate, Halogencarbonsäuren, Triazine, Amide, Harnstoffe, Diphenylether, Triazinone, Uracile, Benzofuranderivate, Cyclohexan-1,3-dionederivate, Chinolincarbonsäurederivate, Aryloxy-, Heteroaryloxypheoxypropionsäuren sowie deren Salze, Ester und Amide in Betracht.

Außerdem kann es von Nutzen sein, die Verbindungen I allein oder in Kombination mit anderen Herbiziden auch noch mit weiteren Pflanzenschutzmitteln gemischt gemeinsam auszubringen, beispielsweise mit Mitteln zur Bekämpfung von Schädlingen oder phytopathogenen Pilzen bzw. Bakterien. Von Interesse ist ferner die Mischbarkeit mit Mineralsalzlösungen, welche zur Behebung von Ernährungs- und Spurenelementmängeln eingesetzt werden. Es können auch nichtphytotoxische Öle und Ölkonzentrate zugesetzt werden.

Die Aufwandsmengen an Wirkstoff bei Anwendung als Herbicide betragen je nach Bekämpfungsziel, Jahreszeit, Zielpflanzen und Wachstumsstadium 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 3 kg/ha aktive Substanz.

Die Verbindungen der Formel I können praktisch alle Entwicklungsstadien einer Pflanze verschiedenartig beeinflussen und werden deshalb auch als Wachstumsregulatoren eingesetzt. Die Wirkungsvielfalt der Pflanzenwachstumsregulatoren hängt ab vor allem

- 50 a) von der Pflanzenart und -sorte,
- b) von dem Zeitpunkt der Applikation, bezogen auf das Entwicklungsstadium der Pflanze, und von der Jahreszeit,
- c) von dem Applikationsort und -verfahren (Samenbeize, Bodenbehandlung, Blattapplikation oder Stamm-injektion bei Bäumen)
- d) von klimatischen Faktoren, z.B. Temperatur, Niederschlagsmenge, außerdem auch Tageslänge und Lichtintensität
- e) von der Bodenbeschaffenheit (einschließlich Düngung),
- f) von der Formulierung bzw. Anwendungsform des Wirkstoffs und schließlich

g) von den angewend ten Konzentrationen der aktiven Substanz.

Die erfindungsgemäß zu verwendend n Wachstumsregulatoren der Formel I können den Kulturpflanzen sowohl vom Samen her (als Saatgutbeizmittel) als auch über den Boden, d.h. durch die Wurzel sowie - besonders bevorzugt - durch Spritzung über das Blatt zugeführt werden.

- 5 Infolge der hohen Pflanzenverträglichkeit kann die Aufwandmenge stark variiert werden.

Die Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der Formel I sind auch geeignet, Schädlinge aus der Klasse der Insekten, Spinnentiere und Nematoden wirksam zu bekämpfen. Sie können im Pflanzenschutz sowie auf dem Hygiene-, Vorratsschutz- und Veterinärsektor als Schädlingsbekämpfungsmittel eingesetzt werden.

- Zu den schädlichen Insekten gehören aus der Ordnung der Schmetterlinge (Lepidoptera) beispielsweise
 10 Agrotis ypsilon, Agrotis segetum, Alabama argillacea, Anticarsia gemmatalis, Argyresthia conjugella, Auto-grapha gamma, Bupalus piniarius, Cacoecia murinana, Capua reticulana, Cheimatobia brumata, Choristoneura fumiferana, Choristoneura occidentalis, Cirphis unipuncta, Cydia pomonella, Dendrolimus pini, Diaphania nitidalis, Diatraea griseosella, Earias insulana, Elasmopalpus lignosellus, Eupococila ambiguella, Eretia bouiana, Feltia subterranea, Galleria mellonella, Grapholita funebrana, Grapholita molesta, Heliothis armigera, Heliothis virescens, Heliothis zea, Hellula undalis, Hibernia defoliaria, Hyphantria cunea, Hyponomeuta malinellus, Keiferia lycopersicella, Lambdina fiscellaria, Laphygma exigua, Leucoptera coffeella, Leucoptera scitella, Lithocolletis blancarella, Lobesia botrana, Loxostege sticticalis, Lymantria dispar, Lymantria monacha, Lyonetia clerkella, Malacosoma neustria, Mamestra brassicae, Orgyia pseudotsugata, Ostrinia nubilalis, Panolis flammea, Pectinophora gossypiella, Peridroma saucia, Phalera bucephala, Phthonomaea operculella,
 15 20 Phyllocoptis citrella, Pieris brassicae, Plathypena scarbra, Plutella xylostella, Pseudoplusia includens, Phyacionia frustrana, Scrobipalpula absoluta, Sitotroga cerealella, Sparganothis pilleriana, Spodoptera frugiperda, Spodoptera littoralis, Spodoptera litura, Thaumatopoea pityocampa, Tortrix viridana, Trichoplusia ni, Zeiraphera canadensis.

- Aus der Ordnung der Käfer (Coleoptera) beispielsweise Agrilus sinuatus, Agriotes lineatus, Agriotes obscurus, Amphimallus solstitialis, Anisandrus dispar, Anthonomus grandis, Anthonomus pomorum, Atomaria linearis, Blastophagus piniperda, Blitophaga undata, Bruchus rufimanus, Bruchus pisorum, Bruchus latus, Byctiscus betulae, Cassida nebulosa, Cerotoma trifurcata, Ceuthorrhynchus assimilis, Ceuthorrhynchus napi, Chaetocnema tibialis, Conoderus vespertinus, Crioceris asparagi, Diabrotica longicornis, Diabrotica 12-punctata, Diabrotica virgifera, Epilachna varivestis, Epitrix hirtipennis, Eutinobothrus brasiliensis, Hylobius abietis, Hypera brunneipennis, Hypera postica, Ips typographus, Lema bilineata, Lema melanopus, Leptinotarsa decemlineata, Limonius californicus, Lissorhoptrus oryzophilus, Melanotus communis, Meligethes aeneus, Melolontha hippocastani, Melolontha melolontha, Onthophagus oryzae, Otiorrhynchus sulcatus, Otiorrhynchus ovatus, Phaedon cochleariae, Phyllotreta chrysocephala, Phyllophaga sp., Phyllopertha horticola, Phyllotreta nemorum, Phyllotreta striolata, Popillia japonica, Sitona lineatus, Sitophilus granaria.

- 35 Aus der Ordnung der Zweiflügler (Diptera) beispielsweise Aedes aegypti, Aedes vexans, Anastrepha ludens, Anopheles maculipennis, Ceratitis capitata, Chrysomya bezziana, Chrysomya hominivorax, Chrysomya macellaris, Contarinia sorghicola, Cordylobia anthropophaga, Culex pipiens, Dacus cucurbitae, Dacus oleae, Dasineura brassicae, Fannia canicularis, Gasterophilus intestinalis, Glossia morsitans, Haematobia irritans, Haplodiplosis equestris, Hylemyia platura, Hypoderma lineata, Liriomyza sativae, Liriomyza trifolii, 40 Lucilia caprina, Lucilia cuprina, Lucilia sericata, Lycoria pectoralis, Mayetiola destructor, Musca domestica, Muscina stabulans, Oestrus ovis, Oscinella frit, Pegomya hyoscyami, Phorbia antiqua, Phorbia brassicae, Phorbia coarctata, Rhagoletis cerasi, Rhagoletis pomonella, Tabanus bovinus, Tipula oleracea, Tipula paludosa.

- Aus der Ordnung der Thripse (Thysanoptera) beispielsweise Frankliniella fusca, Frankliniella occidentalis, Frankliniella tritici, Scirtothrips citri, Thrips oryzae, Thrips palmi, Thrips tabaci.

Aus der Ordnung der Hautflügler (Hymenoptera) beispielsweise Athalia rosae, Atta cephalotes, Atta sexdens, Atta texana, Hoplocampa minuta, Hoplocampa testudinea, Monomorium pharaonis, Solenopsis geminata, Solenopsis invicta.

- Aus der Ordnung der Wanzen (Heteroptera) beispielsweise Acrosternum hilare, Blissus leucopterus, 50 Cyrtopeltis notatus, Dysdercus cingulatus, Dysdercus intermedius, Eurygaster integriceps, Euchistus impictiventris, Leptoglossus phyllopus, Lygus lineolaris, Lygus pratensis, Nezara viridula, Piesma quadrata, Solubea insularis, Thyanta perditor.

- Aus der Ordnung der Pflanzensauber (Homoptera) beispielsweise Acyrthosiphon onobrychidis, Adelges laricis, Aphidula nasturtii, Aphis fabae, Aphis pomi, Aphis sambuci, Brachycaudus cardui, Brachycaudus brassicae, Cerosiphaga gossypii, Dreyfusia nordmanniana, Dreyfusia piceae, Dyaphorophyia radicola, Dysaphis pseudosolani, Empoasca fabae, Macrosiphum avenae, Macrosiphum euphorbiae, Macrosiphum rosae, Megoura viciae, Metopolophium dirhodum, Myzodes persicae, Myzus cerasi, Nilaparvata lugens, Paphigus bursarius, Perkinsiella saccharicida, Phorodon humuli, Psylla mali, Psylla pisi, Rhopalomyzus ascalonicus,

Rhopalosiphum maidis, Sappaphis mala, Sappaphis mali, Schizaphis graminum, Schizoneura lanuginosa, Trialeurodes vaporariorum, Viteus vitifolii.

Aus der Ordnung der Termiten (Isoptera) beispielsweise Calotermes flavigollis, Leucotermes flavipes, Reticulitermes lucifugus, Termes natalensis.

5 Aus der Ordnung der Gerafflügler (Orthoptera) beispielsweise Acheta domestica, Blatta orientalis, Blattella germanica, Forficula auricularia, Gryllotalpa gryllotalpa, Locusta migratoria, Melanoplus bimaculatus, Melanoplus femur-rubrum, Melanoplus mexicanus, Melanoplus sanguinipes, Melanoplus spretus, Nomadacris septemfasciata, Periplaneta americana, Schistocerca americana, Schistocerca peregrina, Stauronotus maroccanus, Tachycines asynamorus.

10 Aus der Klasse der Arachnoidea, beispielsweise Spinnentiere (Acarina) wie Amblyomma americanum, Amglyomma variegatum, Argas persicus, Boophilus annulatus, Boophilus decoloratus, Boophilus microplus, Brevipalpus phoenicis, Bryobia praetiosa, Dermacentor silvarum, Eotetranychus carpi, Eriophyes sheldoni, Hyalomma truncatum, Ixodes ricinus, Ixodes rubicundus, Ornithodoros moubata, Otobius megnini, Paratetranychus pilosus, Permanyssus gallinae, Phyllocoptes oleivora, Polyphagotarsonemus latus, Psoroptes ovis,

15 Rhipicephalus appendiculatus, Rhipicephalus evertsii, Sarcopes scabiei, Tetranychus cinnabarinus, Tetranychus kanzawai, Tetranychus pacificus, Tetranychus telarius, Tetranychus urticae.

Aus der Klasse der Nematoden, beispielsweise Wurzelgallenwurm, z.B. Meloidogyne hapla, Meloidogyne incognita, Meloidogyne javanica, Zysten bildende Nematoden, z.B. Globodera rostochiensis, Heterodera avenae, Heterodera glycinae, Heterodera schatii, Heterodera trifolii, Stock- und Blattläuse, z.B.

20 Belonolaimus longicaudatus, Ditylenchus destructor, Ditylenchus dipsaci, Heliocotylenchus multicinctus, Longidorus elongatus, Radopholus similis, Rotylenchus robustus, Trichodorus primitivus, Tylenchorhynchus claytoni, Tylenchorhynchus dubius, Pratylenchus neglectus, Pratylenchus penetrans, Pratylenchus curvitarsis, Pratylenchus goodeyi.

Bei der Verwendung der Verbindungen I als Insektizide können die Wirkstoffkonzentrationen in den 25 anwendungsfertigen Zubereitungen in größeren Bereichen variiert werden.

Im allgemeinen liegen sie zwischen 0,01 und 95 Gew.-%, vorzugsweise zwischen 0,1 und 70 Gew.-%.

Die Wirkstoffe können auch mit gutem Erfolg im Ultra-Low-Volume-Verfahren (ULV) verwendet werden, wobei es möglich ist, Formulierungen mit mehr als 95 Gew.-% Wirkstoff oder sogar den Wirkstoff ohne Zusätze auszubringen.

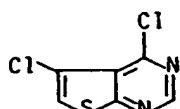
30 Die Aufwandmenge an Wirkstoff beträgt unter Freilandbedingungen zweckmäßig 0,001 bis 5, vorzugsweise 0,01 bis 3 kg/ha.

Synthesebeispiele

35 Die in den nachstehenden Synthesebeispielen wiedergegebenen Vorschriften wurden unter entsprechender Abwandlung der Ausgangsverbindungen zur Gewinnung weiterer Verbindungen I benutzt. Die so erhaltenen Verbindungen sind in der Tabelle I mit ihren Schmelzpunkten aufgeführt.

Beispiel 1

40 70 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen wurden bei Raumtemperatur in 250 ml Phosphorylchlorid (POCl_3) eingetragen. Zu diesem Reaktionsgemisch wurden innerhalb von 20 Minuten 38 ml Dimethylformamid (DMF) zugetropft und die Lösung anschließend eine Stunde bei Raumtemperatur und 2,5 Stunden bei 75 °C gerührt. Danach wurde das Gemisch auf 2,5 kg Eis gegeben und der Niederschlag 45 abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50 °C getrocknet. Man erhielt 95,8 g (94 % d. Th.) der Verbindung der Formel



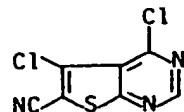
vom Schmelzpunkt 161-162 °C.

Beispiel 2

69 g 2-Aldehydo-2-amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen wurden bei Raumtemperatur in 135 ml

5 Phosphorylchlorid (POCl_3) eingetragen. Zu diesem Reaktionsgemisch wurden innerhalb von 20 Minuten 20 ml Dimethylformamid (DMF) zugetropft und die Lösung anschließend eine Stunde bei 20°C und 3 Stunden bei 75°C gerührt. Danach wurde das Gemisch auf 1 kg Eis gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 50,2 g (81 % d. Th.) der Verbindung der Formel

10



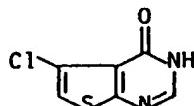
vom Schmelzpunkt $155\text{--}157^\circ\text{C}$.

15 Beispiel 3

Variante a:

In 150 ml tert.-Butanol wurden 2,5 g elementares Natrium gelöst. Hierzu wurden 10,2 g 4,5-Dichlor-
20 thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde eine Stunde bei 20°C und 4 Stunden bei 50°C gerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Wasser eingerührt und mit Salzsäure auf pH 7 eingestellt. Der Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 7,6 g (37 % d. Th.) der Verbindung der Formel

25



30

vom Schmelzpunkt $245\text{--}248^\circ\text{C}$.

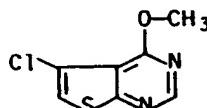
Variante b:

35 In 67 ml DMF wurden 20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gelöst. Hierzu wurden bei Raumtemperatur 17,6 g 25 gew.-%ige wäßrige Natronlauge getropft. Das Reaktionsgemisch wurde 16 Stunden bei Raumtemperatur gerührt. Anschließend wurden weitere 17,6 g 25 gew.-%ige wäßrige Natronlauge zugetropft. Nach 24 Stunden Röhren bei 20°C wurde das Reaktionsgemisch auf 500 ml Wasser gegeben und mit Salzsäure auf pH 7 eingestellt. Der Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 16,4 g (88 % d. Th.) der Verbindung, welche mit dem nach Variante a erhaltenen Produkt identisch ist.

Beispiel 4

45 20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 150 ml Methanol suspendiert. Hierzu wurden 13,3 g Natriummethanolat gegeben. Danach wurde das Reaktionsgemisch eine Stunde bei Raumtemperatur und eine weitere Stunde bei $50\text{--}60^\circ\text{C}$ gerührt. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch auf 500 ml Wasser gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50°C getrocknet. Man erhielt 15 g (75 % d. Th.) der Verbindung der Formel

50



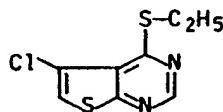
55

mit einem Schmelzpunkt von $145\text{--}146^\circ\text{C}$.

Beispiel 5

- 5 g 5-Chlor-4-thio-3,4-dihydro-thieno[2,3-d]pyrimidin wurden in 50 ml DMF und 5 ml Triethylamin gelöst. Hierzu wurden tropfenweise 5,4 g Bromethan gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 4 Stunden bei Raumtemperatur gerührt und anschließend in 500 ml Wasser eingerührt. Der Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50 °C getrocknet. Man erhielt 4,9 g (85 % d. Th.) der Verbindung der Formel

10



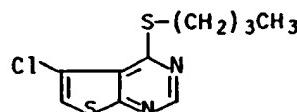
- 15 mit einem Schmelzpunkt von 64-66 °C.

Beispiel 6

- 10,2 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 50 ml DMF und 4,5 g Pyridin gelöst. Hierzu wurden bei Raumtemperatur 4,5 g n-Butanthiol gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde eine Stunde bei Raumtemperatur und weitere 2 Stunden bei 50-60 °C gerührt. Anschließend wurden im Vakuum 10 ml Lösungsmittel abdestilliert. Der Rückstand wurde auf 500 ml Wasser gegeben, der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50 °C getrocknet. Man erhielt 9 g (70 % d. Th.) der Verbindung der Formel

25

30



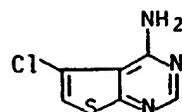
- mit einem Schmelzpunkt von 118-120 °C.

Beispiel 7

35

- 20,5 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) wurden in 67 ml Dimethylformamid (DMF) gelöst. Hierzu wurden 12,4 g conc. Ammoniak, gelöst in 12 ml Wasser, getropft und das Reaktionsgemisch wurde 15 Stunden bei 50 °C gerührt. Anschließend wurde das Gemisch auf 500 ml Wasser gegeben und der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum bei 50 °C getrocknet. Man erhielt 15,5 g (84 % d. Th.) der Verbindung der Formel

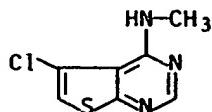
45



- vom Schmelzpunkt 260-262 °C.

50 Beispiel 8

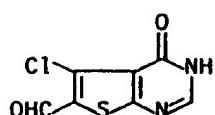
- Zu 50 ml einer 40 % wäßrigen Methylaminlösung in 20 ml Dimethylformamid wurden bei 20 °C 15 g 4,5-Dichlor-thieno[2,3-d]pyrimidin (Beispiel 1) gegeben. Das Reaktionsgemisch wurde 4 Stunden bei 20 °C gerührt. Anschließend wurde das Gemisch in 500 ml Wasser gegeben und der Niederschlag abgesaugt. Der Niederschlag wurde mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Man erhielt 11,5 g (79 % d. Th.) der Verbindung der Formel



vom Schmelzpunkt 211-212 °C.

Beispiel 9

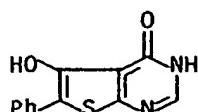
10 12,1 g 4-Chlor-3-cyano-5-formyl-2-dimethylaminoformamidinothiophen und 50 ml Chlorbenzol wurden 3 Stunden bei Raumtemperatur sowie weitere 6 Stunden bei 100 °C mit gasförmigem HCl begast. Anschließend wurde überschüssiges HCl mit Preßluft entfernt. Dem Reaktionsgemisch wurde dann 50 ml Wasser zugesetzt. Der sich daraufhin gebildete Niederschlag wurde abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im
15 Vakuum getrocknet. Es wurden 5,6 g (52 %) der Verbindung der Formel



vom Schmelzpunkt 212 °C (Zersetzung) erhalten.

25 Beispiel 10

30 33 g 2-Amino-3-carboxamido-4-oxo-4,5-dihydro-5-phenyl-thiophen wurden in 200 ml Ameisensäure 14 Stunden bei 100 °C und weitere 16 Stunden unter Rückfluß gerührt. Nach dem Abkühlen wurde der Niederschlag abgesaugt, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Es wurden 21,8 g (64 %) der
35 Verbindung der Formel

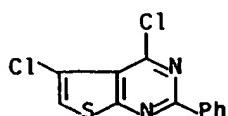


vom Schmelzpunkt über 290 °C erhalten.

40 Beispiel 11

Variante a:

45 Zu einer Suspension von 14 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen und 50 ml Phosphorylchlorid wurden portionsweise 19,6 g Benzoesäuremorpholid zugegeben. Anschließend wurde das Reaktionsgemisch eine Stunde bei Raumtemperatur und weitere drei Stunden bei 78 °C gerührt. Dann wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Eiswasser gegossen. Der dabei angefallene Niederschlag wurde abfiltriert, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Es wurden 23,3 g (83 %) der Verbindung der Formel



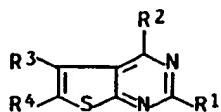
55 vom Schmelzpunkt 138 - 140 °C erhalten.

Variante b:

Zu einer Suspension von 70 g 2-Amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydro-thiophen und 250 ml Phosphorylchlorid wurden 88,5 g Benzoesäurediethylamid zugegeben. Danach wurde das Reaktionsgemisch 0,5 Stunden bei 20 °C und 3 Stunden bei 78 °C gerührt. Dann wurde das Reaktionsgemisch in 500 ml Eiswasser gegossen. Der dabei angefallene Niederschlag wurde abfiltriert, mit Wasser gewaschen und im Vakuum getrocknet. Dabei fielen 10,7 g (76 %) der unter Variante a erhaltenen Verbindung an.

In analoger Weise lassen sich die in Tabelle 1 aufgeführten Verbindungen herstellen.

Tabelle 1



	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R2	Rest R3	Rest R4	Schmelzpunkt (°C)
15	12	H	Cl	Cl	CH ₃	97- 99
20	13	H	O-C ₂ H ₅	Cl	H	124
	14	H	O-nC ₃ H ₇	Cl	H	105-107
	15	H	O-isoC ₃ H ₇	Cl	H	80- 81
	16	H	O-nC ₄ H ₉	Cl	H	94- 95
25	17	H	O-isoC ₄ H ₉	Cl	H	79- 80
	18	H	O-CH ₂ CH(OCH ₃)CH ₃	Cl	H	66- 67
	19	H	O-sekC ₄ H ₉	Cl	H	ö1
30	20	H	O-nC ₅ H ₁₁	Cl	H	65- 66
	21	H	O-NeoC ₅ H ₁₁	Cl	H	
	22	H	O-nC ₆ H ₁₃	Cl	H	ö1
	23	H	O-nC ₇ H ₁₅	Cl	H	ö1
35	24	H	O-nC ₈ H ₁₇	Cl	H	ö1
	25	H	O-isoC ₈ H ₁₇	Cl	H	
	26	H	O-nC ₉ H ₁₉	Cl	H	
40	27	H	O-nC ₁₀ H ₂₁	Cl	H	
	28	H	O-nC ₁₁ H ₂₃	Cl	H	
	29	H	O-nC ₁₂ H ₂₅	Cl	H	
	30	H	O-nC ₁₃ H ₂₇	Cl	H	
45	31	H	O-nC ₁₄ H ₃₁	Cl	H	
	32	H	O-nC ₁₅ H ₃₁	Cl	H	
	33	H	O-nC ₁₆ H ₃₁	Cl	H	
50	34	H	O-nC ₁₇ H ₃₃	Cl	H	
	35	H	O-nC ₁₈ H ₃₅	Cl	H	
	36	H	O-nC ₁₉ H ₃₇	Cl	H	
	37	H	O-nC ₂₀ H ₃₉	Cl	H	
55	38	H	O-CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	95- 98

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	39	H	O-CH ₂ -C≡CH	C1	H	154-156
	40	H	O-Cyclopropyl	C1	H	
10	41	H	O-Cyclobutyl	C1	H	
	42	H	O-Cyclopentyl	C1	H	85- 87
	43	H	O-Cyclohexyl	C1	H	90- 94
15	44	H	O-Cycloheptyl	C1	H	Öl
	45	H	O-Cyclooctyl	C1	H	
	46	H	O-Cyclononyl	C1	H	
	47	H	O-Cyclodecyl	C1	H	
20	48	H	O-Cyclododecyl	C1	H	
	49	H	O-Cyclohexyl-(2)-CH ₃	C1	H	
	50	H	O-C ₆ H ₅	C1	H	106-108
25	51	H	O-C ₆ H ₄ -(4)-CH ₃	C1	H	
	52	H	O-CH ₂ -C ₆ H ₅	C1	H	99-100
	53	H	O-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-CH ₃	C1	H	
	54	H	O-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-C(CH ₃) ₃	C1	H	
30	55	H	O-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	C1	H	77- 78
	56	H	O-CH ₂ CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-OCH ₃	C1	H	
	57	H	O-CH ₂ CH ₂ OH	C1	H	
35	58	H	O-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C1	H	107-109
	59	H	O-CH ₂ CH ₂ OC ₂ H ₅	C1	H	104-105
	60	H	O-CH ₂ CH ₂ O-nC ₃ H ₇	C1	H	60- 62
	61	H	O-CH ₂ CH ₂ O-nC ₄ H ₉	C1	H	
40	62	H	O-CH ₂ CH ₂ -NH-CH ₂ CH ₂ OH	C1	H	117-119
	63	H	O-CH ₂ CH ₂ -N(CH ₃) ₂	C1	H	80- 84
	64	H	O-CH ₂ CH ₂ -N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	
45	65	H	O-(CH ₂) ₃ OH	C1	H	
	66	H	O-(CH ₂) ₃ OCH ₃	C1	H	
	67	H	O-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	C1	H	
	68	H	O-CH ₂ CH ₂ O-nC ₃ H ₇	C1	H	
50	69	H	O-CH ₂ CH ₂ O-nC ₄ H ₉	C1	H	
	70	H	O-(CH ₂) ₃ -N(CH ₃) ₂	C1	H	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
	71	H	O-(CH ₂) ₃ -N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	
	72	H	O-CH(CH ₃)-CH ₂ O-nC ₄ H ₉	Cl	H	
10	73	H	O-CH(C ₂ H ₅)-CH ₂ OCH ₃	Cl	H	
	74	H	O-(CH ₂) ₅ -CH ₂ Cl	Cl	H	
	75	H	O-(CH ₂) ₇ -CH ₂ Cl	Cl	H	
15	76	H	S-H	Cl	H	264
	77	H	S-CH ₃	Cl	H	
	78	H	S-n-C ₃ H ₇	Cl	H	271
	79	H	S-iso-C ₃ H ₇	Cl	H	260
20	80	H	S-iso-C ₄ H ₉	Cl	H	153-155
	81	H	S-sek-C ₄ H ₉	Cl	H	148-150
	82	H	S-tert-C ₄ H ₉	Cl	H	160-163
25	83	H	S-n-C ₆ H ₁₃	Cl	H	
	84	H	S-n-C ₈ H ₁₇	Cl	H	
	85	H	S-n-C ₁₂ H ₂₅	Cl	H	
	86	H	S-n-C ₁₆ H ₃₃	Cl	H	
30	87	H	S-n-C ₁₈ H ₃₇	Cl	H	
	88	H	S-Cyclohexyl	Cl	H	
	89	H	S-C ₆ H ₅	Cl	H	181-182
35	90	H	S-C ₆ H ₄ -(4)-CH ₃	Cl	H	
	91	H	S-C ₆ H ₄ -(2)-OH	Cl	H	
	92	H	S-C ₆ H ₄ -(4)-OCH ₃	Cl	H	
	93	H	S-C ₆ H ₄ -(4)-Cl	Cl	H	
40	94	H	S-C ₆ H ₃ -(2,6)-Cl ₂	Cl	H	
	95	H	S-CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	H	
	96	H	S-(CH ₂) ₂ -OH	Cl	H	
45	97	H	S-(CH ₂) ₂ -N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	
	98	H	S-CH ₂ CH(CH ₃)-OH	Cl	H	
	99	H	S-(CH ₂) ₂ -COOH	Cl	H	
	100	H	S-CH(CH ₃)-COOH	Cl	H	
50	101	H	S-CH ₂ -COOH	Cl	H	
	102	H	S-CH ₂ -COOCH ₃	Cl	H	105-108

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	103	H	S-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cl	H	105-107
	104	H	S-CH ₂ -(2)-Furyl	Cl	H	
10	105	H	SCN	Cl	H	208-210
	106	H	F	Cl	H	
	107	H	CN	Cl	H	
15	108	H	N ₃	Cl	H	208 Zers.
	109	H	NH-(CH ₂) ₄ -CH ₃	Cl	CH ₃	Öl
	110	H	O-CH ₃	Cl	CH ₃	92- 93
	111	H	O-C ₂ H ₅	Cl	CH ₃	74- 75
20	112	H	O-C ₆ H ₅	Cl	CH ₃	108-109
	113	H	S-H	Cl	CH ₃	241-243
	114	H	S-C ₆ H ₅	Cl	CH ₃	131-133
	115	H	S-CH ₂ -COOC ₂ H ₅	Cl	CH ₃	94- 98
25	116	H	Cl	Cl	CHCl ₂	125-130
	117	H	Cl	Cl	CN	155-157
	118	H	CH ₂ COOC ₂ H ₅	Cl	H	91- 92
30	119	H	CH(COOCH ₂ H ₅) ₂	Cl	H	112-113
	120	H	CH(CN) ₂	Cl	H	
	121	H	CH(CN)COOC ₂ H ₅	Cl	H	158-159
	122	H	CH(CN)COOCH ₃	Cl	H	
35	123	H	CH(COOCH ₃) ₂	Cl	H	
	124	H	CH(CN)C ₆ H ₅	Cl	H	
	125	H	NH-NH-C ₂ H ₅	Cl	H	
	126	H	NH-N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	
40	127	H	S-n-C ₅ H ₁₁	Cl	H	
	128	H	S-Neo-C ₅ H ₁₁	Cl	H	
	129	H	N(CH ₃)-NH-CH ₃	Cl	H	
45	130	H	OH	OH	H	
	131	C ₂ H ₅	OH	OH	H	
	132	C ₂ H ₅	Cl	Cl	H	
	133	nC ₃ H ₇	OH	OH	H	
50	134	nC ₃ H ₇	Cl	Cl	H	
	135	isoC ₃ H ₇	OH	OH	H	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	136	isoC ₃ H ₇	C1	C1	H	
	137	nC ₄ H ₉	OH	OH	H	
	138	nC ₄ H ₉	C1	C1	H	
10	139	CycloC ₃ H ₅	OH	OH	H	
	140	CycloC ₃ H ₅	C1	C1	H	
	141	CycloC ₆ H ₁₁	OH	OH	H	
	142	CycloC ₆ H ₁₁	C1	C1	H	
15	143	H	NH-C ₂ H ₅	C1	H	134-135
	144	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	H	71- 75
	145	H	NH-isoC ₃ H ₇	C1	H	119-120
20	146	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	H	71- 75
	147	H	NH-sekC ₄ H ₉	C1	H	54- 58
	148	H	NH-isoC ₄ H ₉	C1	H	88- 90
	149	H	NH-tertC ₄ H ₉	C1	H	80- 81
25	150	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	H	76- 77
	151	H	NH-sekC ₅ H ₁₁	C1	H	ö1
	152	H	NH-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	C1	H	
	153	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	H	111-114
30	154	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	H	50
	155	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	H	64
	156	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	H	54- 56
35	157	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	H	60- 65
	158	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	H	
	159	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	H	
	160	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	H	
40	161	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	H	
	162	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	H	
	163	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	H	ö1
	164	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	H	ö1
45	165	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -CH(CH ₃) ₂	C1	H	ö1
	166	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₅ -CH ₃	C1	H	
	167	H	NH-CH(C ₂ H ₅)-(CH ₂) ₄ -CH ₃	C1	H	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	168	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	H	ö1
	169	H	(R)-(-)-NH-CH(CH ₃)-Cyclohexyl	C1	H	
10	170	H	(S)-(+)-NH-CH(CH ₃)-Cyclohexyl	C1	H	
	171	H	NH-CH ₂ CH ₂ -Cyclohexyl	C1	H	69- 71
	172	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	143-145
	173	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	H	115-117
15	174	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	H	80- 83
	175	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₆ H ₅	C1	H	
	176	H	NH-(CH ₂) ₂ -O-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
	177	H	NH-(CH ₂) ₂ -NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
20	178	H	NH-(CH ₂) ₂ -NH ₂	C1	H	
	179	H	NH-(CH ₂) ₂ -N(CH ₃) ₂	C1	H	146-148
	180	H	NH-(CH ₂) ₂ -N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	67- 70
25	181	H	NH-(CH ₂) ₂ -N(iso-C ₃ H ₇) ₂	C1	H	
	182	H	NH-(CH ₂) ₂ -Piperazin-(1)-yl	C1	H	
	183	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	H	114-116
	184	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	H	
30	185	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	H	80- 83
	186	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH(CH ₃) ₂	C1	H	42- 43
	187	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₆ H ₅	C1	H	
	188	H	NH-(CH ₂) ₃ -O-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	ö1
35	189	H	NH-(CH ₂) ₃ -O-(CH ₂) ₂ -O-CH ₃	C1	H	
	190	H	NH-(CH ₂) ₃ -O-(CH ₂) ₂ -O-C ₂ H ₅	C1	H	
	191	H	NH-(CH ₂) ₃ -O-(CH ₂) ₂ -O-C ₆ H ₅	C1	H	ö1
	192	H	NH-(CH ₂) ₃ -NH ₂	C1	H	228-230
40	193	H	NH-(CH ₂) ₃ -N(CH ₃) ₂	C1	H	112-115
	194	H	NH-(CH ₂) ₃ -N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	66- 68
	195	H	NH-(CH ₂) ₃ -N(n-C ₄ H ₉) ₂	C1	H	
45	196	H	NH-(CH ₂) ₃ -Morpholin-(1)-yl	C1	H	
	197	H	NH-(CH ₂) ₄ -OH	C1	H	
	198	H	NH-(CH ₂) ₅ -NH ₂	C1	H	
	199	H	NH-(CH ₂) ₆ -OH	C1	H	

50

9

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	200	H	NH-(CH ₂) ₆ -NH ₂	C1	H	
	201	H	NH-(CH ₂) ₇ -NH ₂	C1	H	
	202	H	NH-(CH ₂) ₈ -NH ₂	C1	H	
10	203	H	NH-(CH ₂) ₉ -NH ₂	C1	H	
	204	H	NH-(CH ₂) ₁₀ -NH ₂	C1	H	
	205	H	NH-(CH ₂) ₁₂ -NH ₂	C1	H	
	206	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -N(C ₂ H) ₂ x HCl	C1	H	165-170
15	207	H	NH-CH ₂ -CH(CH ₃)-OH	C1	H	
	208	H	NH-CH(CH ₃)-CH ₂ -OH	C1	H	
	209	H	NH-CH ₂ -(2)-Thienyl	C1	H	
20	210	H	NH-C(CH ₃) ₂ -CH ₂ -OH	C1	H	
	211	H	NH-C(CH ₃)-(CH ₂ -OH) ₂	C1	H	
	212	H	NH-CH(C ₂ H ₅)-CH ₂ -OH	C1	H	
	213	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	H	
25	214	H	NH-(CH ₂) ₅ -COOH	C1	H	
	215	H	NH-(CH ₂) ₁₀ -COOH	C1	H	
	216	H	NH-C ₆ H ₅	C1	H	86- 88
	217	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₃	C1	H	126-128
30	218	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-CH ₃	C1	H	116-118
	219	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-CH ₃	C1	H	162-165
	220	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	H	94- 96
	221	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-C ₂ H ₅	C1	H	71- 73
35	222	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	H	
	223	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-CF ₃	C1	H	98-100
	224	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-CF ₃	C1	H	
40	225	H	NH-C ₆ H ₅ -(2)-OH	C1	H	218-220
	226	H	NH-C ₆ H ₅ -(3)-OH	C1	H	238-241
	227	H	NH-C ₆ H ₅ -(4)-OH	C1	H	219-222
	228	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-OCH ₃	C1	H	167-169
45	229	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-OCH ₃	C1	H	114-115
	230	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-OCH ₃	C1	H	104-107
	231	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-OC ₂ H ₅	C1	H	152-153

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	232	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-OC ₂ H ₅	Cl	H	93- 95
	233	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-OC ₂ H ₅	Cl	H	128-130
	234	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-Cl	Cl	H	126-130
10	235	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-Cl	Cl	H	135-137
	236	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-Cl	Cl	H	191-195
	237	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-F	Cl	H	
15	238	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-F	Cl	H	
	239	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-F	Cl	H	
	240	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-Br	Cl	H	
	241	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-Br	Cl	H	
20	242	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-Br	Cl	H	
	243	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-I	Cl	H	
	244	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-I	Cl	H	
	245	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-I	Cl	H	
25	246	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-NH ₂	Cl	H	154-156
	247	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-NH ₂	Cl	H	182-185
	248	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-NH ₂	Cl	H	184-185
	249	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-NH-COCH ₃	Cl	H	210-212
30	250	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₂ OH	Cl	H	
	251	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-CH ₂ OH	Cl	H	
	252	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-COCH ₃	Cl	H	194-195
35	253	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-COOH	Cl	H	
	254	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-COOH	Cl	H	
	255	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-COOH	Cl	H	
	256	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CONH ₂	Cl	H	
40	257	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-CONH ₂	Cl	H	
	258	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CN	Cl	H	
	259	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-CN	Cl	H	
	260	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-CN	Cl	H	210-213
45	261	H	NH-C ₆ H ₃ -(2,6)-(CH ₃) ₂	Cl	H	
	262	H	NH-C ₆ H ₃ -(3,5)-(CH ₃) ₂	Cl	H	
	263	H	NH-C ₆ H ₃ -(2)-OH-(5)-CH ₃	Cl	H	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	264	H	NH-C ₆ H ₃ -(2)-OH-(4)-CH ₃	Cl	H	258
	265	H	NH-C ₆ H ₃ -(2)-OH-(2)-CH ₃	Cl	H	
10	266	H	NH-C ₆ H ₃ -(2)-OH-(5)-Cl	Cl	H	
	267	H	NH-(2)-Pyridyl	Cl	H	175- 6
	268	H	NH-(3)-Pyridyl	Cl	H	138-140
	269	H	NH-(4)-Pyridyl	Cl	H	
15	270	H	NH-(2)-(4'-Methyl-pyridyl)	Cl	H	
	271	H	NH-(2)-(5'-Methyl-pyridyl)	Cl	H	
	272	H	NH-(2)-(6'-Methyl-pyridyl)	Cl	H	
20	273	H	NH-CH ₂ -(3)-Pyridyl	Cl	H	
	274	H	NH-CH ₂ -(2)-Furyl	Cl	H	
	275	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	H	98- 99
	276	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(2)-OCH ₃	Cl	H	
25	277	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-OCH ₃	Cl	H	118-120
	278	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-F	Cl	H	
	279	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(2)-Cl	Cl	H	
30	280	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₄ -(4)-Cl	Cl	H	
	281	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₃ -(3,4)-(OCH ₃) ₂	Cl	H	
	282	H	NH-CH ₂ -CH ₂ -C ₆ H ₅	Cl	H	83
	283	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅ (+/-)	Cl	H	76- 78
35	284	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	Cl	H	
	285	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅	Cl	H	
	286	H	NH-Cyclopropyl	Cl	H	87
40	287	H	NH-Cyclopentyl	Cl	H	79- 80
	288	H	NH-Cyclohexyl	Cl	H	85- 86
	289	H	NH-Cycloheptyl	Cl	H	62- 63
	290	H	NH-Cyclooctyl	Cl	H	43- 48
45	291	H	NH-Cyclododecyl	Cl	H	119-122
	292	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	Cl	H	85- 86
	293	H	NH-CH ₂ -C≡CH	Cl	H	171-173
50	294	H	N(CH ₃) ₂	Cl	H	108-110
	295	H	N(C ₂ H ₅) ₂	Cl	H	42- 45

Tabelle 1 (Fortsetzung)

5	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	R st R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
	296	H	N(n-C ₃ H ₇) ₂	C1	H	ö1
	297	H	N(n-C ₄ H ₉) ₂	C1	H	ö1
10	298	H	N(iso-C ₄ H ₉) ₂	C1	H	69- 72
	299	H	N(n-C ₅ H ₁₁) ₂	C1	H	ö1
	300	H	N(sek-C ₄ H ₉) ₂	C1	H	
15	301	H	N(iso-C ₅ H ₁₁) ₂	C1	H	
	302	H	N(n-C ₆ H ₁₃) ₂	C1	H	ö1
	303	H	N(CH(C ₂ H ₅)-(CH ₂) ₄ -CH ₃) ₂	C1	H	
	304	H	N(n-C ₈ H ₁₇) ₂	C1	H	
20	305	H	N(CH ₂ -CH=CH ₂) ₂	C1	H	ö1
	306	H	N(Cyclohexyl) ₂	C1	H	ö1
	307	H	N(CH ₃)-nC ₄ H ₉	C1	H	
25	308	H	N(CH ₃)-Cyclohexyl	C1	H	
	309	H	N(C ₂ H ₅)-Cyclohexyl	C1	H	ö1
	310	H	N(CH ₃)-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
	311	H	N(C ₂ H ₅)-CH(CH ₃)-CH(CH ₃) ₂	C1	H	
30	312	H	N(C ₂ H ₅)-(CH) ₂ -OH	C1	H	
	313	H	N(C ₂ H ₅)-CH ₂ -CH(OH)-CH ₃	C1	H	
	314	H	N(tert-C ₄ H ₉)-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
35	315	H	N(CH ₃)C ₆ H ₅	C1	H	165-167
	316	H	N(C ₂ H ₅)-C ₆ H ₅	C1	H	
	317	H	N(iso-C ₃ H ₇)-C ₆ H ₅	C1	H	
	318	H	N(nC ₄ H ₉)-C ₆ H ₅	C1	H	
40	319	H	N(CH ₂ C ₆ H ₅) ₂	C1	H	101-102
	320	H	N(CH ₃)-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	321	H	N(C ₂ H ₅)-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
45	322	H	N(iso-C ₃ H ₇)-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	323	H	N(tert-C ₄ H ₉)-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	324	H	N(CH ₂ C ₆ H ₅)-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
	325	H	N(C ₆ H ₅)-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
50	326	H	N(CH ₂ C ₆ H ₅)-((CH ₂) ₂ -C ₆ H ₅)	C1	H	
	327	H	Pyrrolidino	C1	H	110-112

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	328	H	Piperidino	C1	H	102-105
	329	H	Hexamethylenimino	C1	H	255-256
10	330	H	Morpholino	C1	H	162-165
	331	H	N-Methylpiperazino	C1	H	116-120
	332	H	NH-NH ₂	C1	H	229-230
15	333	H	NH-NH-CH ₃	C1	H	
	334	H	NH-NH-C ₆ H ₅	C1	H	134-136
	335	H	NH-N(CH ₃) ₂	C1	H	
	336	H	NH-Morpholin-(1)-yl	C1	H	
	337	H	NH-Hexamethylenimino-(1)-yl	C1	H	
20	338	H	NH-OH	C1	H	
	339	CH ₃	NH-CH ₃	C1	H	148-150
	340	CH ₃	NH-C ₂ H ₅	C1	H	208-210
	341	CH ₃	NH-nC ₃ H ₇	C1	H	150-151
25	342	CH ₃	NH-isOC ₃ H ₇	C1	H	
	343	CH ₃	NH-sekC ₄ H ₉	C1	H	187-190
	344	CH ₃	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	H	60- 62
	345	CH ₃	NH-Cyclohexyl	C1	H	
30	346	CH ₃	NH-C ₆ H ₅	C1	H	109-112
	347	CH ₃	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	208-210
	348	CH ₂ Cl	NH-CH ₃	C1	H	
35	349	CH ₂ Cl	NH-C ₂ H ₅	C1	H	93- 97
	350	H	NH-CH ₃	C1	CH ₃	186-187
	351*)	H	NH-C ₂ H ₅	C1	CH ₃	128-130
	352*)	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	CH ₃	61- 65
40	353*)	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	CH ₃	61- 65
	354	H	NH-sekC ₄ H ₉	C1	CH ₃	101-102
	355	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	CH ₃	43- 44
	356	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	CH ₃	53- 54
45	357	H	NH-C ₂ H ₄ -OH	C1	CH ₃	155-159
	358	H	NH-C ₂ H ₄ -OCH ₃	C1	CH ₃	87- 88
	359	H	NH-Cyclohexyl	C1	CH ₃	111-112

50 *) HCl-Salz

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	360	H	NH-C ₆ H ₅	C1	CH ₃	169-171
	361	H	NH-C ₆ H ₄ -(3)-CH ₃	C1	CH ₃	152-154
10	362	H	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	CH ₃	183-186
	363	H	N(CH ₃) ₂	C1	CH ₃	60- 64
	364	H	Pyrrolidino	C1	CH ₃	75- 76
	365	H	Piperidino	C1	CH ₃	128-130
15	366	H	Morpholino	C1	CH ₃	105-106
	367	H	NH-NH ₂	C1	CH ₃	194-195
	368	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	CN	99-102
	369	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	CN	90- 92
20	370	H	NH-sekC ₄ H ₉	C1	CN	82- 84
	371	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	CN	82- 84
	372	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	CN	60- 62
25	373	H	NH-CH ₃	C1	CH=N-CH ₃	206-208
	374	H	NH-isoC ₃ H ₇	C1	CH=N-isoC ₃ H ₇	105-112
	375	H	(R/S)-NH-CH(CH ₃)-Cyclohexyl	C1	H	
	376	H	NH-(CH ₂) ₃ -N(n-C ₃ H ₇) ₂	C1	H	
30	377	H	NH-(CH ₂) ₃ -N(isoC ₃ H ₇) ₂	C1	H	
	378	H	NH-(+)-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	H	
	379	H	NH-(-)-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	H	
	380	H	NH-Cyclobutyl	C1	H	
35	381	H	NH-Adamantyl	C1	H	
	382	H	NH-Cyclononyl	C1	H	
	383	H	NH-Cyclodecyl	C1	H	
	384	H	NH-Metallyl	C1	H	
40	385	H	N(IsoC ₃ H ₇) ₂	C1	H	
	386	H	N-Ethylpiperazino	C1	H	
	387	H	Thiomorpholino	C1	H	
45	388	H	NH-NH-C ₂ H ₅	C1	H	
	389	H	NH-N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	
	390	H	N(CH ₃)-NH-CH ₃	C1	H	
	391	H	Imidazol-1-yl	C1	H	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	392	H	Pyrazol-1-yl	C1	H	
	393	H	Triazol-1-yl	C1	H	
10	394	H	Tetrazol-1-yl	C1	H	
	395	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	H	ö1
	396	H	NH-CH(CH ₃)-CH ₂ CN	C1	H	123-125
15	397	H	N(CH ₃)-CH(CH ₃)-CH ₂ CN	C1	H	84- 90
	398	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	H	ö1
	399	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	CH ₃	ö1
	400	CH ₃	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	H	150-152
20	401	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	H	187-190
	402	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	CN	64- 65
	403	H	SCN	C1	CH ₃	162-165
25	404	H	NH-C ₆ H ₅	C1	CH=N-C ₆ H ₅	180-183
	405	H	NH-(CH ₂) ₂ -Cyclohexyl	C1	CH ₃	73- 74
	406	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	CN	64- 65
	407	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	CH=N-nC ₃ H ₇	77- 83
30	408	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CH ₃	82- 84
	409	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	CH ₃	41- 43
	410	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	CH ₃	121-123
35	411	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ -CH ₃	C1	CH ₃	ö1
	412	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	CH ₃	ö1
	413	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	CH ₃	71- 72
	414	H	NH-CH ₂ -C ₆ H ₅	C1	CH ₃	133-134
40	415	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	CH ₃	ö1
	416	H	NH-C ₆ H ₂ -(4)-NH ₂ -(3,5)-Cl ₂	C1	H	242
	417	H	NH-(CH ₂) ₃ -O-(CH ₂) ₂ O(CH ₂) ₂ OC ₂ H ₅	C1	H	ö1
45	418	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₂ CH(CH ₃) ₂	C1	CH ₃	ö1
	419	H	O-CH(CH ₃)-CH ₂ OCH ₃	C1	H	ö1
	420	H	O-CH(CH ₃)-CH ₂ OC ₆ H ₅	C1	H	80- 82
	421	H	S-CH ₂ C≡CH	C1	H	170-172
50	422	H	S-CH ₂ CH=CH ₂	C1	H	58- 62
	423	H	NH-C ₆ H ₄ -(4)-COOC ₂ H ₅	C1	H	158-162

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	424	H	NH-nC ₈ H ₁₇	Cl	CN	45-46
	425	H	NH-CH ₂ -CH(C ₂ H ₅)-(CH ₂) ₃ CH ₃	Cl	H	ö1
	426	H	NH-(CH ₂) ₃ OC ₂ H ₅	Cl	CN	70-74
10	427	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	Cl	H	ö1
	428	H	S-nC ₅ H ₁₁	Cl	H	170-172
	429	H	S-CH(CH ₂ CH ₂ CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	Cl	H	ö1
15	430	H	NH-(CH ₂) ₈ -CH=CH-(CH ₂) ₇ CH ₃	Cl	H	ö1
	431	CH ₃	Cl	Cl	H	126-130
	432	CH ₂ Cl	Cl	Cl	H	120-124
	433	H	Thiomorpholino-S,S-dioxid	Cl	H	über 300
20	434	H	NH-CH ₃	Cl	CHO	
	435	H	NH-C ₂ H ₅	Cl	CHO	
	436	H	NH-nC ₃ H ₇	Cl	CHO	
	437	H	NH-isoC ₃ H ₇	Cl	CHO	
25	438	H	NH-nC ₄ H ₉	Cl	CHO	
	439	H	NH-isoC ₄ H ₉	Cl	CHO	
	440	H	NH-secC ₄ H ₉	Cl	CHO	
	441	H	NH-tertC ₄ H ₉	Cl	CHO	
30	442	H	NH-nC ₅ H ₁₁	Cl	CHO	
	443	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	Cl	CHO	
	444	H	NH-nC ₆ H ₁₃	Cl	CHO	85-87
35	445	H	NH-nC ₇ H ₁₅	Cl	CHO	
	446	H	NH-nC ₈ H ₁₇	Cl	CHO	49-54
	447	H	NH-nC ₉ H ₁₉	Cl	CHO	
	448	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	Cl	CHO	ö1
40	449	H	NH-nC ₁₁ H ₂₃	Cl	CHO	ö1
	450	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	Cl	CHO	ö1
	451	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	Cl	CHO	ö1
	452	H	NH-nC ₁₄ H ₂₉	Cl	CHO	ö1

45

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	453	H	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	CHO	öl
	454	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	CHO	öl
	455	H	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	CHO	öl
10	456	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	CHO	öl
	457	H	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	CHO	öl
	458	H	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	CHO	öl
15	459	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	CHO	öl
	460	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	CHO	öl
	461	H	NH-C ₆ H ₅	C1	CHO	
	462	H	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CHO	
20	463	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CHO	
	464	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	CHO	
	465	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	CHO	
	466	H	NH-CH ₂ -COOH	C1	CHO	
25	467	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	CHO	
	468	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	CHO	
	469	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	CHO	öl
30	470	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	CHO	
	471	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	CHO	
	472	C ₆ H ₅	Thiomorpholino-S,S-dioxid	C1	H	
	473	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	CHO	
35	474	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	CHO	
	475	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	CHO	
	476	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	CHO	
	477	H	NH-Cyclopropyl	C1	CHO	
40	478	H	NH-Cyclopentyl	C1	CHO	
	479	H	NH-Cyclohexyl	C1	CHO	
	480	H	NH-Cycloheptyl	C1	CHO	
	481	H	NH-Cyclooctyl	C1	CHO	
45	482	H	NH-Cyclododecyl	C1	CHO	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	483	C ₆ H ₅	NH-CH ₃	C1	H	
	484	C ₆ H ₅	NH-C ₂ H ₅	C1	H	
10	485	C ₆ H ₅	NH-nC ₃ H ₇	C1	H	
	486	C ₆ H ₅	NH-isoC ₃ H ₇	C1	H	
	487	C ₆ H ₅	NH-nC ₄ H ₉	C1	H	97-98
15	488	C ₆ H ₅	NH-isoC ₄ H ₉	C1	H	
	489	C ₆ H ₅	NH-secC ₄ H ₉	C1	H	
	490	C ₆ H ₅	NH-tertC ₄ H ₉	C1	H	
20	491	C ₆ H ₅	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	H	68-70
	492	C ₆ H ₅	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	H	
	493	C ₆ H ₅	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	H	
	494	C ₆ H ₅	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	H	
25	495	C ₆ H ₅	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	H	
	496	C ₆ H ₅	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	H	
	497	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	H	ö1
30	498	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₁ H ₂₃	C1	H	ö1
	499	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	H	ö1
	500	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	H	ö1
	501	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₄ H ₂₉	C1	H	ö1
35	502	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	H	ö1
	503	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	H	ö1
	504	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	H	ö1
40	505	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	H	ö1
	506	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	H	ö1
	507	C ₆ H ₅	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	H	ö1
	508	C ₆ H ₅	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	H	ö1
45	509	C ₆ H ₅	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	H	ö1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	510	C ₆ H ₅	NH-C ₆ H ₅	C1	H	
	511	C ₆ H ₅	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
10	512	C ₆ H ₅	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	513	C ₆ H ₅	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	H	
	514	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	H	
	515	C ₆ H ₅	NH-CH ₂ -COOH	C1	H	
15	516	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	H	
	517	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	H	
	518	C ₆ H ₅	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ - CH(CH ₃) ₂	C1	H	ö1
20	519	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
	520	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	H	
	521	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	H	
	522	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	H	
25	523	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	H	
	524	C ₆ H ₅	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	H	
	525	C ₆ H ₅	NH-Cyclopropyl	C1	H	
	526	C ₆ H ₅	NH-Cyclopentyl	C1	H	
30	527	C ₆ H ₅	NH-Cyclohexyl	C1	H	
	528	C ₆ H ₅	NH-Cycloheptyl	C1	H	
	529	C ₆ H ₅	NH-Cyclooctyl	C1	H	
	530	C ₆ H ₅	NH-Cyclododecyl	C1	H	
35	531	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	CHO	
	532	H	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	CHO	
	533	H	NH-Methallyl	C1	CHO	
	534	C ₆ H ₅	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	H	
40	535	C ₆ H ₅	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	H	
	536	C ₆ H ₅	NH-Methallyl	C1	H	
	537	H	NH-CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
45	538	H	NH-C ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	539	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	COOC ₂ H ₅	
	540	H	NH-isoC ₃ H ₇	C1	COOC ₂ H ₅	
10	541	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	542	H	NH-isoC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	543	H	NH-secC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	544	H	NH-tertC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
15	545	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	COOC ₂ H ₅	
	546	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	COOC ₂ H ₅	
	547	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	548	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	COOC ₂ H ₅	
20	549	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	COOC ₂ H ₅	
	550	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	551	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
25	552	H	NH-nC ₁₁ H ₂₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	553	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	554	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	555	H	NH-nC ₁₄ H ₂₉	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
30	556	H	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	557	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	558	H	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	559	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
35	560	H	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	561	H	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	562	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	563	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
40	564	H	NH-C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	565	H	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	566	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	567	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
45						

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelzpunkt (°C)
5	568	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	569	H	NH-CH ₂ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
10	570	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
	571	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
	572	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH(CH ₃) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	573	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	COOC ₂ H ₅	
15	574	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	COOC ₂ H ₅	
	575	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	576	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
20	577	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	578	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	579	H	NH-Cyclopropyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	580	H	NH-Cyclopentyl	C1	COOC ₂ H ₅	
25	581	H	NH-Cyclohexyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	582	H	NH-Cycloheptyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	583	H	NH-Cyclooctyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	584	H	NH-Cyclododecyl	C1	COOC ₂ H ₅	
30	585	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	586	H	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	COOC ₂ H ₅	
	587	H	NH-Methallyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	588	H	NH-CH ₃	C1	CONH ₂	
35	589	H	NH-C ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
	590	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	CONH ₂	
	591	H	NH-iSoC ₃ H ₇	C1	CONH ₂	
	592	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	CONH ₂	
40	593	H	NH-iSoC ₄ H ₉	C1	CONH ₂	
	594	H	NH-secC ₄ H ₉	C1	CONH ₂	
	595	H	NH-tertC ₄ H ₉	C1	CONH ₂	
45	596	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	CONH ₂	

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	597	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	CONH ₂	
	598	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	CONH ₂	
10	599	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	CONH ₂	
	600	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	CONH ₂	
	601	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	CONH ₂	
	602	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	CONH ₂	
15	603	H	NH-nC ₁₁ H ₂₃	C1	CONH ₂	ö1
	604	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	CONH ₂	ö1
	605	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	CONH ₂	ö1
	606	H	NH-nC ₁₄ H ₂₉	C1	CONH ₂	ö1
20	607	H	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	CONH ₂	ö1
	608	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	CONH ₂	ö1
	609	H	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	CONH ₂	ö1
25	610	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	CONH ₂	ö1
	611	H	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	CONH ₂	ö1
	612	H	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	CONH ₂	ö1
	613	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	CONH ₂	ö1
30	614	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	CONH ₂	ö1
	615	H	NH-C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
	616	H	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
	617	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
35	618	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
	619	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
	620	H	NH-CH ₂ -COOH	C1	CONH ₂	
	621	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	CONH ₂	
40	622	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	CONH ₂	
	623	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	CONH ₂	ö1
	624	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	CONH ₂	
45	625	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	CONH ₂	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	626	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	CONH ₂	
	627	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
	628	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	CONH ₂	
10	629	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
	630	H	NH-Cyclopropyl	C1	CONH ₂	
	631	H	NH-Cyclopentyl	C1	CONH ₂	
15	632	H	NH-Cyclohexyl	C1	CONH ₂	
	633	H	NH-Cycloheptyl	C1	CONH ₂	
	634	H	NH-Cyclooctyl	C1	CONH ₂	
	635	H	NH-Cyclododecyl	C1	CONH ₂	
20	636	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	CONH ₂	
	637	H	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	CONH ₂	
	638	H	NH-Methylallyl	C1	CONH ₂	
	639	H	NH-CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
25	640	H	NH-C ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	641	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	COOC ₂ H ₅	
	642	H	NH-isoC ₃ H ₇	C1	COOC ₂ H ₅	
	643	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
30	644	H	NH-isoC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	645	H	NH-secC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	646	H	NH-tertC ₄ H ₉	C1	COOC ₂ H ₅	
35	647	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	COOC ₂ H ₅	
	648	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	COOC ₂ H ₅	
	649	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	650	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	COOC ₂ H ₅	
40	651	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	COOC ₂ H ₅	
	652	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	COOC ₂ H ₅	
	653	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	654	H	NH-nC ₁₁ H ₂₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1

45

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	655	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	656	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
10	657	H	NH-nC ₁₄ H ₂₉	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	658	H	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	659	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	660	H	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
15	661	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	662	H	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	663	H	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	664	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
20	665	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	666	H	NH-C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	667	H	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	668	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
25	669	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	670	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	671	H	NH-CH ₂ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
30	672	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
	673	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	COOC ₂ H ₅	
	674	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
	675	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	COOC ₂ H ₅	
35	676	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	COOC ₂ H ₅	
	677	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	678	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
40	679	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	680	H	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	681	H	NH-Cyclopropyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	682	H	NH-Cyclopentyl	C1	COOC ₂ H ₅	
45	683	H	NH-Cyclohexyl	C1	COOC ₂ H ₅	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	684	H	NH-Cycloheptyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	685	H	NH-Cyclooctyl	C1	COOC ₂ H ₅	
10	686	H	NH-Cyclododecyl	C1	COOC ₂ H ₅	
	687	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	688	H	NH-CH ₂ -C≡CH	C1	COOC ₂ H ₅	
	689	H	NH-Methylallyl	C1	COOC ₂ H ₅	
15	690	H	NH-CH ₃	C1	COOCH ₃	
	691	H	NH-C ₂ H ₅	C1	COOCH ₃	
	692	H	NH-nC ₃ H ₇	C1	COOCH ₃	
	693	H	NH-isoC ₃ H ₇	C1	COOCH ₃	
20	694	H	NH-nC ₄ H ₉	C1	COOCH ₃	
	695	H	NH-isoC ₄ H ₉	C1	COOCH ₃	
	696	H	NH-secC ₄ H ₉	C1	COOCH ₃	
25	697	H	NH-tertC ₄ G ₉	C1	COOCH ₃	
	698	H	NH-nC ₅ H ₁₁	C1	COOCH ₃	
	699	H	NH-NeoC ₅ H ₁₁	C1	COOCH ₃	
	700	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	COOCH ₃	
30	701	H	NH-nC ₇ H ₁₅	C1	COOCH ₃	
	702	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	COOCH ₃	
	703	H	NH-nC ₉ H ₁₉	C1	COOCH ₃	
	704	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	COOCH ₃	ö1
35	705	H	NH-nC ₁₁ H ₂₃	C1	COOCH ₃	ö1
	706	H	NH-nC ₁₂ H ₂₅	C1	COOCH ₃	ö1
	707	H	NH-nC ₁₃ H ₂₇	C1	COOCH ₃	ö1
	708	H	NH-nC ₁₄ H ₂₉	C1	COOCH ₃	ö1
40	709	H	NH-nC ₁₅ H ₃₁	C1	COOCH ₃	ö1
	710	H	NH-nC ₁₆ H ₃₃	C1	COOCH ₃	ö1
	711	H	NH-nC ₁₇ H ₃₅	C1	COOCH ₃	ö1
45	712	H	NH-nC ₁₈ H ₃₇	C1	COOCH ₃	ö1
	713	H	NH-nC ₁₉ H ₃₉	C1	COOCH ₃	ö1

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	714	H	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	COOCH ₃	ö1
	715	H	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	COOCH ₃	ö1
10	716	H	NH-CH(CH ₃)-(CH ₂) ₃ CH ₃	C1	COOCH ₃	ö1
	717	H	NH-C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
	718	H	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
	719	H	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
15	720	H	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
	721	H	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
	722	H	NH-CH ₂ -COOH	C1	COOCH ₃	
20	723	H	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	COOCH ₃	
	724	H	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	COOCH ₃	
	725	H	NH-(CH(CH ₃))-(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	COOCH ₃	ö1
	726	H	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	COOCH ₃	
25	727	H	NH-(CH ₂) ₃ -OH	C1	COOCH ₃	
	728	H	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	COOCH ₃	
	729	H	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	COOCH ₃	
30	730	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	COOCH ₃	
	731	H	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₅	C1	COOCH ₃	
	732	H	NH-Cyclopropyl	C1	COOCH ₃	
	733	H	NH-Cyclopentyl	C1	COOCH ₃	
35	734	H	NH-Cyclohexyl	C1	COOCH ₃	
	735	H	NH-Cycloheptyl	C1	COOCH ₃	
	736	H	NH-Cyclooctyl	C1	COOCH ₃	
	737	H	NH-Cyclododecyl	C1	COOCH ₃	
40	738	H	NH-CH ₂ -CH=CH ₂	C1	COOCH ₃	
	739	H	NH-CH ₂ -C≡CH ₂	C1	COOCH ₃	
	740	H	NH-Methallyl	C1	COOCH ₃	
	741	H	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	COOH	
45	742	H	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	COOH	
	743	H	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	COOH	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	744	CH ₃	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	CHO	
	745	CH ₃	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	CHO	
10	746	CH ₃	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	CHO	
	747	C ₆ H ₅	NH-nC ₆ H ₁₃	C1	CHO	
	748	C ₆ H ₅	NH-nC ₈ H ₁₇	C1	CHO	
	749	C ₆ H ₅	NH-nC ₁₀ H ₂₁	C1	CHO	
15	750	CH ₂ Cl ₂	C1	C1	H	97-99
	751	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	CHO	ö1
	752	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₃	C1	CHO	
	753	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	CHO	
20	754	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	CHO	
	755	H	NH-(CH ₂) ₃ -isoC ₃ H ₇	C1	CHO	
	756	H	NH-(CH ₂) ₃ -CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CHO	
	757	H	N(CH ₃) ₂	C1	CHO	
25	758	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	CHO	
	759	H	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	CHO	
	760	H	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	CHO	
30	761	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	CHO	
	762	H	Pyrrolidino	C1	CHO	
	763	H	Piperidino	C1	CHO	
	764	H	Hexamethylenimino	C1	CHO	
35	765	H	Morpholino	C1	CHO	
	766	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	CHO	ö1
	767	H	S-CH ₃	C1	CHO	
	768	H	S-C ₂ H ₅	C1	CHO	
40	769	H	S-nC ₃ H ₇	C1	CHO	
	770	H	S-CH ₂ -CH=CH ₃	C1	CHO	
	771	H	SCN	C1	CHO	
	772	H	O-CH ₃	C1	CHO	
45	773	H	O-C ₂ H ₅	C1	CHO	
	774	H	O-nC ₃ H ₇	C1	CHO	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	775	H	O—CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C1	CHO	
	776	H	O—CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	C1	CHO	
10	777	C ₆ H ₅	CH(CH ₃)—(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	H	ö1
	778	C ₆ H ₅	NH—C ₆ H ₄ —(2)—CH ₃	C1	H	
	779	C ₆ H ₅	NH—C ₆ H ₄ —(2)—C ₂ H ₅	C1	H	
	780	C ₆ H ₅	NH—C ₆ H ₄ —(2)—CF ₃	C1	H	
15	781	C ₆ H ₅	NH—(CH ₂) ₃ —isoC ₃ H ₇	C1	H	
	782	C ₆ H ₅	NH—(CH ₂) ₃ —CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	783	C ₆ H ₅	N(CH ₃) ₂	C1	H	
	784	C ₆ H ₅	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	
20	785	C ₆ H ₅	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	H	
	786	C ₆ H ₅	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	H	
	787	C ₆ H ₅	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	H	
25	788	C ₆ H ₅	Pyrrolidino	C1	H	
	789	C ₆ H ₅	Piperidino	C1	H	
	790	C ₆ H ₅	Hexamethylenimino	C1	H	
	791	C ₆ H ₅	Morpholino	C1	H	
30	792	C ₆ H ₅	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	H	
	793	C ₆ H ₅	S—CH ₃	C1	H	
	794	C ₆ H ₅	S—C ₂ H ₅	C1	H	
	795	C ₆ H ₅	S—nC ₃ H ₇	C1	H	
35	796	C ₆ H ₅	S—CH ₂ —CH=CH ₃	C1	H	
	797	C ₆ H ₅	SCN	C1	H	
	798	C ₆ H ₅	O—CH ₃	C1	H	
	799	C ₆ H ₅	O—C ₂ H ₅	C1	H	
40	800	C ₆ H ₅	O—nC ₃ H ₇	C1	H	
	801	C ₆ H ₅	O—CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C1	H	
	802	C ₆ H ₅	O—CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	C1	H	
	803	H	NH—CH(CH ₃)—(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	CONH ₂	ö1
45	804	H	NH—C ₆ H ₄ —(2)—CH ₃	C1	CONH ₂	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	805	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
	806	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	CONH ₂	
10	807	H	NH-(CH ₂) ₃ -isoC ₃ H ₇	C1	CONH ₂	
	808	H	NH-(CH ₂) ₃ -CH ₂ C ₆ H ₅	C1	CONH ₂	
	809	H	N(CH ₃) ₂	C1	CONH ₂	
	810	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	CONH ₂	
15	811	H	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	CONH ₂	
	812	H	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	CONH ₂	
	813	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	CONH ₂	
	814	H	Pyrrolidino	C1	CONH ₂	
20	815	H	Piperidino	C1	CONH ₂	
	816	H	Hexamethylenimino	C1	CONH ₂	
	817	H	Morpholino	C1	CONH ₂	
25	818	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	CONH ₂	
	819	H	S-CH ₃	C1	CONH ₂	
	820	H	S-C ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
	821	H	S-nC ₃ H ₇	C1	CONH ₂	
30	822	H	S-CH ₂ -CH=CH ₃	C1	CONH ₂	
	823	H	SCN	C1	CONH ₂	
	824	H	O-CH ₃	C1	CONH ₂	
	825	H	O-C ₂ H ₅	C1	CONH ₂	
35	826	H	O-nC ₃ H ₇	C1	CONH ₂	
	827	H	O-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C1	CONH ₂	
	828	H	O-CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	C1	CONH ₂	
	829	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	COOH	81
40	830	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₃	C1	COOH	
	831	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	COOH	
	832	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	COOH	
	833	H	NH-(CH ₂) ₃ -isoC ₃ H ₇	C1	COOH	
45	834	H	NH-(CH ₂) ₃ -CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOH	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	835	H	N(CH ₃) ₂	C1	COOH	
	836	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	COOH	
10	837	H	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	COOH	
	838	H	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	COOH	
	839	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	COOH	
	840	H	Pyrrolidino	C1	COOH	
15	841	H	Piperidino	C1	COOH	
	842	H	Hexamethylenimino	C1	COOH	
	843	H	Morpholino	C1	COOH	
	844	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	COOH	
20	845	H	S-CH ₃	C1	COOH	
	846	H	S-C ₂ H ₅	C1	COOH	
	847	H	S-nC ₃ H ₇	C1	COOH	
	848	H	S-CH ₂ -CH=CH ₃	C1	COOH	
25	849	H	SCN	C1	COOH	
	850	H	O-CH ₃	C1	COOH	
	851	H	O-C ₂ H ₅	C1	COOH	
30	852	H	O-nC ₃ H ₇	C1	COOH	
	853	H	O-CH ₂ CH ₂ OCH ₃	C1	COOH	
	854	H	O-CH ₂ CH(CH ₃)OCH ₃	C1	COOH	
	855	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	COOCH ₃	
35	856	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₃	C1	COOCH ₃	
	857	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	COOCH ₃	
	858	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	COOCH ₃	
	859	H	NH-(CH ₂) ₃ -isoC ₃ H ₇	C1	COOCH ₃	
40	860	H	NH-(CH ₂) ₃ -CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOCH ₃	
	861	H	N(CH ₃) ₂	C1	COOCH ₃	
	862	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	COOCH ₃	
	863	H	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	COOCH ₃	
45	864	H	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	COOCH ₃	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	865	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	COOCH ₃	
	866	H	Pyrrolidino	C1	COOCH ₃	
10	867	H	Piperidino	C1	COOCH ₃	
	868	H	Hexamethylenimino	C1	COOCH ₃	
	869	H	Morpholino	C1	COOCH ₃	
	870	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	COOCH ₃	
15	871	H	S-CH ₃	C1	COOCH ₃	
	872	H	S-C ₂ H ₅	C1	COOCH ₃	
	873	H	S-nC ₃ H ₇	C1	COOCH ₃	
	874	H	S-CH ₂ -CH=CH ₃	C1	COOCH ₃	
20	875	H	SCN	C1	COOCH ₃	
	876	H	O-CH ₃	C1	COOCH ₃	
	877	H	CH(CH ₃)-(CH ₂) ₄ CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	ö1
25	878	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	879	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-C ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	880	H	NH-C ₆ H ₄ -(2)-CF ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	881	H	NH-(CH ₂) ₃ -isoC ₃ H ₇	C1	COOC ₂ H ₅	
30	882	H	NH-(CH ₂) ₃ -CH ₂ C ₆ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	
	883	H	N(CH ₃) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	884	H	N(C ₂ H ₅) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	885	H	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
35	886	H	N(nC ₄ H ₉) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	887	H	N(CH ₂ CH=CH ₂) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
	888	H	Pyrrolidino	C1	COOC ₂ H ₅	
	889	H	Piperidino	C1	COOC ₂ H ₅	
40	890	H	Hexamethylenimino	C1	COOC ₂ H ₅	
	891	H	Morpholino	C1	COOC ₂ H ₅	
	892	H	N(CH ₂ CH ₂ OCH ₃) ₂	C1	COOC ₂ H ₅	
45	893	H	S-CH ₃	C1	COOC ₂ H ₅	
	894	H	S-C ₂ H ₅	C1	COOC ₂ H ₅	

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R1	Rest R2	Rest R3	Rest R4	Schmelz- punkt (°C)
5	895	H	S-nC ₃ H ₇	Cl	COOC ₂ H ₅	
	896	H	S-CH ₂ -CH=CH ₃	Cl	COOC ₂ H ₅	
	897	H	SCN	Cl	COOC ₂ H ₅	
10	898	H	O-C ₂ H ₅	Cl	COOC ₂ H ₅	
	899	H	O-nC ₃ H ₇	Cl	COOnC ₃ H ₇	
	900	H	O-nC ₄ H ₉	Cl	COOnC ₄ H ₉	
15	901	H	O-nC ₅ H ₁₁	Cl	COOnC ₅ H ₁₁	
	902	H	O-nC ₆ H ₁₃	Cl	COOnC ₆ H ₁₃	
	903	H	Cl	Cl	C ₆ H ₅	262-266
	904	CH ₃	NH ₂	Cl	H	
20	905	CH ₃	NH-nC ₄ H ₉	Cl	H	37-40
	906	CH ₃	NH-isoC ₄ H ₉	Cl	H	
	907	CH ₃	NH-tertC ₄ H ₉			
	908	CH ₃	NH-isoC ₅ H ₁₁	Cl	H	
25	909	CH ₃	NH-NeoC ₅ H ₁₁	Cl	H	
	910	CH ₃	NH-nC ₆ H ₁₃	Cl	H	59-60
	911	CH ₃	NH-nC ₇ H ₁₅	Cl	H	
	912	CH ₃	NH-nC ₈ H ₁₇	Cl	H	
30	913	CH ₃	NH-nC ₉ H ₁₉	Cl	H	ö1
	914	CH ₃	NH-nC ₁₀ H ₂₁	Cl	H	ö1
	915	CH ₃	NH-nC ₁₁ H ₂₃	Cl	H	ö1
35	916	CH ₃	NH-nC ₁₂ H ₂₅	Cl	H	ö1
	917	CH ₃	NH-nC ₁₃ H ₂₇	Cl	H	ö1
	918	CH ₃	NH-nC ₁₄ H ₂₉	Cl	H	ö1
	919	CH ₃	NH-nC ₁₅ H ₃₁	Cl	H	ö1
40	920	CH ₃	NH-nC ₁₆ H ₃₃	Cl	H	ö1
	921	CH ₃	NH-nC ₁₇ H ₃₅	Cl	H	ö1
	922	CH ₃	NH-nC ₁₈ H ₃₇	Cl	H	ö1
	923	CH ₃	NH-nC ₁₉ H ₃₉	Cl	H	ö1

45

50

55

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
5	924	CH ₃	NH-nC ₂₀ H ₄₁	C1	H	ö1
	925	CH ₃	NH-CH(CH ₃)CH ₂ CH ₂ CH ₃	C1	H	ö1
10	926	CH ₃	NH-CH(CH ₃)- -(CH ₂) ₃ -CH ₃	C1	H	ö1
	927	CH ₃	NH-CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
	928	CH ₃	NH-CH ₂ CH ₂ C ₆ H ₅	C1	H	
15	929	CH ₃	NH-CH(CH ₃)-C ₆ H ₅	C1	H	
	930	CH ₃	NH-(CH ₂) ₃ -C ₆ H ₅	C1	H	
	931	CH ₃	NH-CH ₂ -COOH	C1	H	
	932	CH ₃	NH-(CH ₂) ₂ -COOH	C1	H	
20	933	CH ₃	NH-(CH ₂) ₃ -COOH	C1	H	
	934	CH ₃	NH-CH(CH ₃)- -(CH ₂) ₃ -CH(CH ₃) ₂	C1	H	
	935	CH ₃	NH-(CH ₂) ₂ -OH	C1	H	
	936	CH ₃	NH-(CH ₂) ₂ -OCH ₃	C1	H	
25	937	CH ₃	NH-(CH ₂) ₂ -OC ₂ H ₅	C1	H	
	938	CH ₃	NH-(CH ₂) ₃ -OCH ₃	C1	H	
	939	CH ₃	NH-(CH ₂) ₃ -OC ₂ H ₅	C1	H	
	940	CH ₃	NH-Cyclopropyl	C1	H	
30	941	CH ₃	NH-Cyclobutyl	C1	H	
	942	CH ₃	NH-Cyclopentyl	C1	H	
	943	CH ₃	NH-Cycloheptyl	C1	H	
35	944	CH ₃	NH-Cyclooctyl	C1	H	
	945	CH ₃	NH-Cyclononyl	C1	H	
	946	CH ₃	NH-Cyclodecyl	C1	H	
	947	CH ₃	NH-Cyclododecyl	C1	H	
40	948	CH ₃	N(CH ₃) ₂	C1	H	
	949	CH ₃	N(nC ₃ H ₇) ₂	C1	H	
	950	CH ₃	Pyrrolidino	C1	H	
	951	CH ₃	Piperidino	C1	H	
45						

Tabelle 1 (Fortsetzung)

	Bsp. Nr.	Rest R ¹	Rest R ²	Rest R ³	Rest R ⁴	Schmelz- punkt (°C)
50	952	CH ₃	Hexamethylenimino	C1	H	
	953	CH ₃	Morpholino	C1	H	
55	954	CH ₃	Thiomorpholino	C1	H	
	955	CH ₃	Thiomorpholino-S,S-dioxid	C1	H	

Anwendungsbeispiele

Die folgenden Beispiele zeigen die insektizide Wirkung der Verbindung n I.

5 Beispiel Nr. 956

Deckel und Boden einer Petrischale wurden mit insgesamt 1 ml einer 0,1 gew.-%igen acetonischen Lösung der Wirkstoffe gleichmäßig ausgekleidet. Nach dem Verdunsten des Lösungsmittels brachte man je 10 Fliegen der Gattung *Musca Domestica* (Stubenfliege) und Wasserwatte in die Schalen ein. Anschließend 10 wurden die Schalen geschlossen. Nach 24 Stunden wurde die Mortalität der Verbindungen durch Abzählen der gestorbenen Fliegen ermittelt.

Tabelle 2

	Synthese-Bsp. Nr.	Mortalität [%]
15	12	100
	147	100
	157	80
	155	80
20	156	100
	168	100
	25	100
	395	100

Beispiel 957

30 Getopfte Buschbohnen, die das zweite Folgeblattpaar zeigten, einen starken Milbenbefall (*Tetranychus telarius*, Rote Spinne (A)) und eine reichliche Eiablage aufwiesen, wurden mit 50 ml wäßriger Wirkstofflösung gleichmäßig besprüht. Nach 5 Tagen wurde die Mortalität der Wirkstoffe mittels eines Mikroskops bestimmt. Die Pflanzen standen in dieser Zeit unter üblichen Gewächshausbedingungen.

35 Tabelle 3

	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
40	155	1000	ca. 90
	156	≤ 1000	100
	157	≤ 1000	100
	395	≤ 1000	100

Beispiel 958

50 Junge Bohnenpflanzen (*Vicia faba*) mit einer starken Kolonie der schwarzen Laus (*Aphis fabae*) wurden mit je 50 ml einer wäßrigen Lösung des Wirkstoffs gleichmäßig besprüht. Nach 24 Stunden wurde die Mortalität der Wirkstoffe bestimmt.

Tabelle 4

	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
5	154	≤ 1000	100
	155	1000	100
	156	1000	100
10	185	1000	100
	395	1000	100

15 Beispiel 959

Auf die Oberfläche eines Nährbodens (5 ml in Kunststoffpetrischälchen, Durchmesser 25 mm, Höhe 10 mm) wurden 0,5 ml einer acetonischen Wirkstofflösung gegeben. Nach dem Verdunsten des Acetons wurde der Nährboden mit 30 µl E.-Coli-Bakterien und 50 µl Nematodensuspension (*Caenorhabditis elegans*) infiziert. Nach 2,8 Stunden wurde die Kontaktwirkung in % Mortalität ermittelt.

Tabelle 5

	Synthese-Bsp. Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
25	147	100	100
	154	4	80
30	155	4	80
	156	10	100
	157	10	100
	168	100	100
35	275	100	100
	282	10	100
	293	100	100
	395	100	100

40

Beispiel 960

Je 5 junge Zecken (*Ornithodoros monstrosus*) wurden in einem wasserdurchlässigen Beutel für 5 sec in eine wäßrige Wirkstoffaufbereitung getaucht. Danach wurden die Beutel für 48 Std. frei aufgehängt und anschließend wurde die Mortalität der Wirkstoffe bestimmt.

	Synthese-Beispiel Nr.	Substanzkonz. [ppm]	Mortalität [%]
50	147	400	100
	154	40	100
	155	1000	100
	156	400	80
55	157	1000	100
	168	20	80

Beispiel 961

Zum Test auf herbizid Wirkungen wurden Samen von verschiedenen Pflanzen in Plastikblumentöpfen mit lehmigem Sand und 3,0 Gew.-% Humus nach Arten getrennt eingepflanzt. Die Pflanzen wurden bis zu einer Größe von 3 bis 15 cm angezogen und dann einer Nachauflaufbehandlung mit den in Wasser suspendierten Wirkstoffen unterzogen. Die Aufwandsmenge betrug 2,0 kg/ha Wirkstoff.

Die in den Gewächshausversuchen verwendeten Pflanzen setzen sich aus folgenden Arten zusammen:

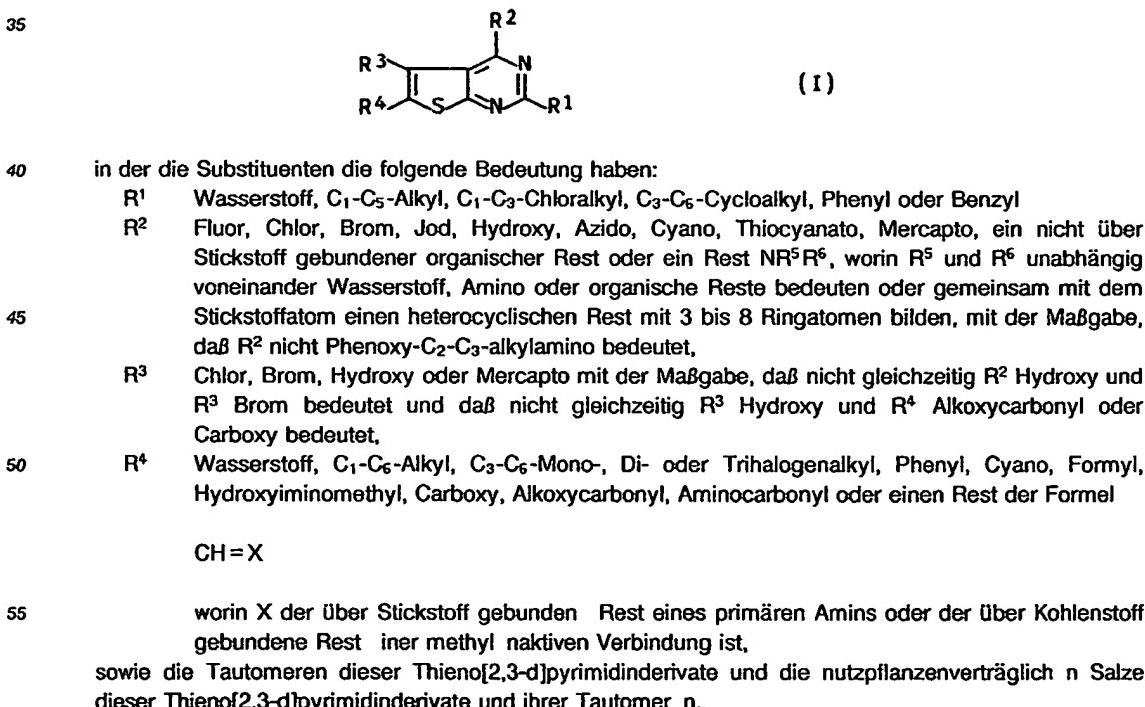
	Abkürzung	Lateinischer Name	Deutscher Name	Englischer Name
10	AMARE	Amaranthus retroflexus	Zurückgekrümpter Fuchsschwanz	redroot pigweed
	GALAP	Galium aparine	Klettenlabkraut	catchweed
15	LAMAM	Lamium amplexicaule	stengelumfassende Taubnessel	bedstraw henbit

Die Versuchsergebnisse wurden nach einer Skala von 0 bis 100 bewertet, wobei 100 bedeutet, daß die Pflanzen völlig zerstört sind und 0 bedeutet das ein normaler Wachstumsverlauf beobachtbar war.

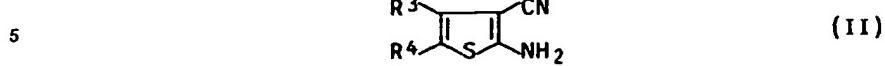
	Synthese-Bsp. Nr.	Testpflanzen und Schädigung		
		AMARE	GALAP	LAMAM
25	144	100	100	90
	146	100	90	70

30 Patentansprüche

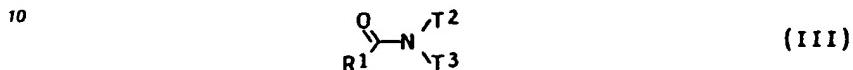
1. Thieno[2,3-d]pyrimidinderivate der allgemeinen Formel I



2. Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel II

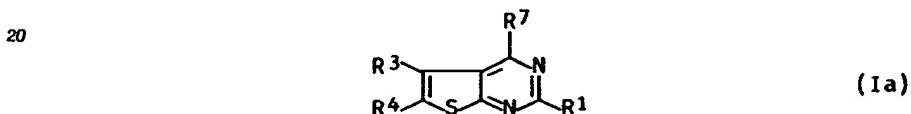


in der R³ und R⁴ die angegebene Bedeutung haben, mit einer Verbindung der allgemeinen Formel III



15

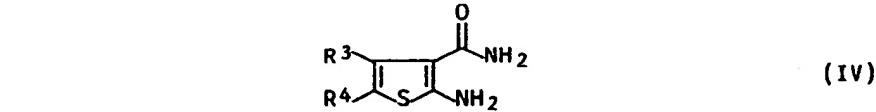
in der R¹ die angegebene Bedeutung hat und T² sowie T³ unabhängig voneinander für C₁-C₄-Alkyl, Phenyl, oder zusammen mit dem Amidstickstoff für einen 5 bis 7gliedrigen gesättigten Heterocyclus stehen, in Gegenwart von 1,1 bis 20 mol Phosphorylchlorid oder Phosphorylbromid, bezogen auf ein Mol II, zu Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel Ia



25

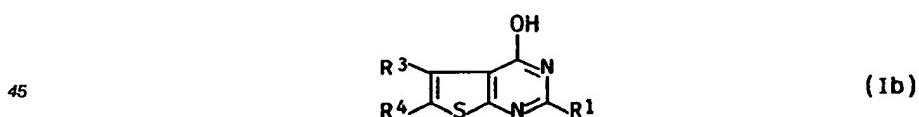
in der R⁷ für Chlor oder Brom steht, umsetzt und in diesen gegebenenfalls R⁷ in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophile Reste R² austauscht.

- 30
3. Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinderivaten der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man Verbindungen der allgemeinen Formel IV



40

in der die Substituenten R³ und R⁴ die in Anspruch 1 angegebene Bedeutung haben, in an sich üblicher Weise mit einem Säureanhydrid, das mindestens einen Rest R¹-CO- enthält, oder einer Carbonsäure R¹-COOH, oder einem Addukt aus einer Carbonsäure R¹-COOH und einer Lewissäure, wobei R¹ jeweils die angegebene Bedeutung hat, zu Verbindungen der allgemeinen Formel Ib



50

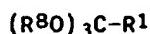
umsetzt, diese mit einem Phosphorylhalogenid in Verbindungen der allgemeinen Formel Ia gemäß Anspruch 2 überführt und in diesen gegebenenfalls R⁷ in an sich üblicher Weise gegen andere nucleophile Reste R² austauscht.

- 55
4. Verfahren zur Herstellung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I nach Anspruch 1, dadurch gekennzeichnet, daß man ein Thiophen der allgemeinen Formel II



in der R³ und R⁴ die angegeben Bedeutung haben, in an sich bekannter Weise mit Orthoestern der allgemeinen Formel V

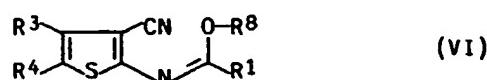
5



(V)

in der R⁸ für einen C₁-C₆-Alkylrest steht, zu Verbindungen der allgemeinen Formel VI

10



15 umsetzt und diese in an sich bekannter Weise in Gegenwart eines den Rest R² enthaltenden Nucleophils in die entsprechenden Verbindungen I überführt.

- 1. 5. Herbizide Mittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine herbizid wirksame Menge eines Thieno[2,3-d]-pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
- 20 6. Schädlingsbekämpfungsmittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine wirksame Menge eines Thieno-[2,3-d]pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
- 25 7. Wachstumsregulierende Mittel, enthaltend einen Trägerstoff und eine wachstumsregulierende Menge eines Thieno[2,3-d]pyrimidinderivates der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1.
- 8. Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schadpflanzen.
- 30 9. Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Bekämpfung von Schädlingen.
- 10. Verwendung von Thieno[2,3-d]pyrimidinen der allgemeinen Formel I gemäß Anspruch 1 zur Regulation des Nutzpflanzenwachstums.

35

40

45

50

55



EINSCHLÄGIGE DOKUMENTE			EP 91103547.5
Kategorie	Kennzeichnung des Dokuments mit Angabe, soweit erforderlich, der maßgeblichen Teile	Betrift Anspruch	KLASSIFIKATION DER ANMELDUNG (Int C14)
D,A	<p><u>DE - A1 - 2 654 090</u> (IMPERIAL CHEMICAL INDUSTRIES LTD) * Ansprüche 1,10,11,2,6 *</p> <p>---</p>	1-10	C 07 D 495/04 A 01 N 49/90
D,A	<p><u>US - A - 4 196 207</u> (WEBBER) * Zusammenfassung *</p> <p>----</p>	1-10	
<p style="text-align: center;">RECHERCHIERTE SACHGEBiete (Int C14)</p> <p style="text-align: center;">C 07 D 495/00</p>			
Der vorliegende Recherchenbericht wurde für alle Patentansprüche erstellt.			
Recherchenort	Abschlußdatum der Recherche	Prüfer	
WIEN	07-05-1991	BRUS	
KATEGORIE DER GENANNTEN DOKUMENTEN			
X : von besonderer Bedeutung allein betrachtet	E : älteres Patentdokument, das jedoch erst am oder nach dem Anmeldedatum veröffentlicht worden ist		
Y : von besonderer Bedeutung in Verbindung mit einer anderen Veröffentlichung derselben Kategorie	D : in der Anmeldung angeführtes Dokument		
A : technologischer Hintergrund	L : aus andern Gründen angeführtes Dokument		
O : nichtschriftliche Offenbarung	& : Mitglied der gleichen Patentfamilie, übereinstimmendes Dokument		
P : Zwischenliteratur			
T : der Erfindung zugrunde liegende Theorien oder Grundsätze			

L8 ANSWER 16 OF 21 CAPLUS COPYRIGHT 2003 ACS
 AN 1991:656224 CAPLUS
 DN 115:256224
 TI Preparation of thieno[2,3-d]pyrimidines as pesticides, herbicides, and plant growth regulators
 IN Wiesenfeldt, Matthias; Etzbach, Karl Heinz; Hofmeister, Peter; Kuenast, Christoph; Westphalen, Karl Otto
 PA BASF A.-G., Germany
 SO Eur. Pat. Appl., 49 pp.
 CODEN: EPXXDW
 DT Patent
 LA German

FAN.CNT 1

	PATENT NO.	KIND	DATE	APPLICATION NO.	DATE
PI	EP 447891	A1	19910925	EP 1991-103547	19910308
	EP 447891	B1	19940427		
	R: BE, CH, DE, DK, ES, FR, GB, IT, LI, NL				
	DE 4008726	A1	19910926	DE 1990-4008726	19900319
	ES 2052296	T3	19940701	ES 1991-103547	19910308
	CA 2038521	AA	19910920	CA 1991-2038521	19910318
JP 04217685	A2	19920807	JP 1991-52079	19910318	

PRAI DE 1990-4008726 19900319

OS MARPAT 115:256224

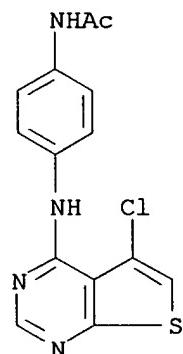
AB Title compds. I [R1 = H, C1-5 alkyl, C1-3 chloroalkyl, C3-6 cycloalkyl, Ph, CH₂Ph; R2 = F, Cl, Br, iodo, OH, N3, NR5R6, etc.; R3 = Cl, Br, OH, SH; R4 = H, C1-6 alkyl, C3-6 haloalkyl, Ph, cyano, CHO, CO₂H, etc.; R5,R6 = H, NH₂, org. group or NR5R6 = 3-8 membered heterocycl; with provisos] were prep'd. Thus 2-amino-3-cyano-4-oxo-4,5-dihydrothiophene was added to POCl₃ at room temp. DMF was added dropwise and the soln. was stirred 1 h at room temp. and 2.5 h at 75.degree. to give title compd. I (R1, R4 = H; R2, R3 = Cl) in 94% yield. Over 300 I were prep'd., with some tested as pesticides, herbicides, etc.

IT 137270-88-3P

RL: AGR (Agricultural use); BAC (Biological activity or effector, except adverse); BSU (Biological study, unclassified); SPN (Synthetic preparation); BIOL (Biological study); PREP (Preparation); USES (Uses) (prepn. of, as pesticide, herbicide, and plant growth regulator)

RN 137270-88-3 CAPLUS

CN Acetamide, N-[4-[(5-chlorothieno[2,3-d]pyrimidin-4-yl)amino]phenyl]- (9CI)
 (CA INDEX NAME)

*I should*